

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2001年9月20日 (20.09.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/68613 A1(51) 国際特許分類: C07D 239/36, 239/47,
403/04, 405/04, 413/04, A01N 43/54

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/02158

(22) 国際出願日: 2001年3月19日 (19.03.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2000-76493 2000年3月17日 (17.03.2000) JP
特願2000-357541
2000年11月24日 (24.11.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 工藤佳宏 (KUDO, Yoshihiro) [JP/JP]. 勝又 章 (KATSUMATA, Akira) [JP/JP]. 前田兼成 (MAEDA, Kazushige) [JP/JP]. 秋山茂明 (AKIYAMA, Shigeaki) [JP/JP]. 八尾坂学 (YAOSAKA, Manabu) [JP/JP]. 森本勝之 (MORI-MOTO, Katsushi) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba (JP). 中平国光 (NAKAHIRA, Kunimitsu) [JP/JP]. 大木 亨 (OHKI, Tooru) [JP/JP]. 濱田暢之 (HAMADA, Nobuyuki) [JP/JP]. 矢野哲彦 (YANO, Tetsuhiko) [JP/JP]. 野口順子 (NOGUCHI, Junko) [JP/JP]. 渡辺重臣 (WATANABE, Shigeomi) [JP/JP]; 〒349-0218 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

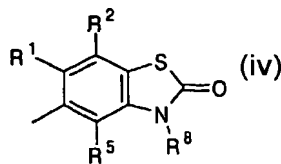
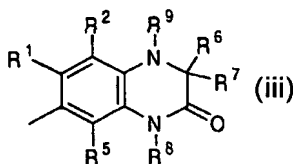
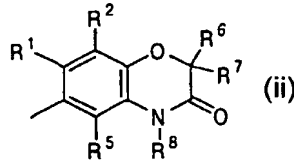
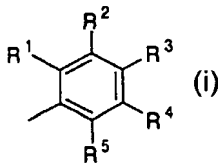
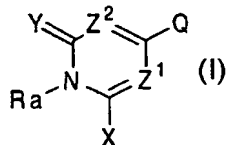
(74) 代理人: 泉名謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 鳥本鋼業ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT,

[続葉有]

(54) Title: PYRIMIDINONE DERIVATIVES AND HERBICIDES

(54) 発明の名称: ピリミジノン誘導体及び除草剤



(57) Abstract: Compounds of the general formula (I) or salts thereof; and pesticides and herbicides, containing the compounds as the active ingredient wherein Ra is hydrogen, cyano, or the like; X is hydrogen, C₁₋₄ alkyl, or the like; Y is O or S; Z¹ and Z² are each independently N or CR_b, wherein R_b is hydrogen, halogeno, or the like, with the proviso that when Z¹ is N, Z² is CR_a, while when Z¹ is CR_a, Z² is N; and Q is a group of the general formula (i), (ii), (iii), (iv) or the like [wherein R¹ and R² are each independently hydrogen or halogeno; R³ is hydrogen, halogeno, or the like; R⁴ is hydrogen, halogeno, or the like; R⁵ is hydrogen, halogeno, or the like; R⁶ and R⁷ are each independently hydrogen, halogeno, or the like; and R⁸ and R⁹ are each independently hydrogen, C₁₋₈ alkyl, or the like].

[続葉有]



WO 01/68613 A1



RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

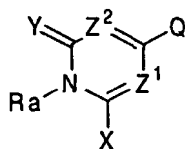
添付公開書類:
— 国際調査報告書

- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

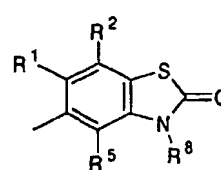
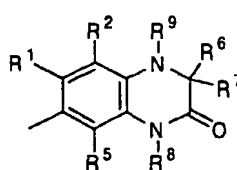
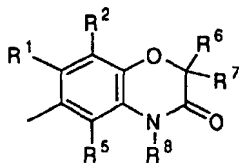
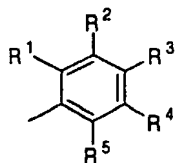
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

新規除草剤の提供。 式 (I) :



[式中、R_aは水素原子、シアノ基等を表し、Xは水素原子、C₁—C₈アルキル基等を表し、YはOまたはSを表し、Z¹及びZ²はそれぞれ独立してNまたはC R_bを表し、R_bは水素原子、ハロゲン原子等を表し、但しZ¹がNを表すときはZ²はC R_aを表し、Z¹がC R_aを表すときはZ²はNを表し、Qは



等を表し、

R¹及びR²はそれぞれ独立しては水素原子またはハロゲン原子を表し、

R³は水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R⁴は水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R⁵は水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R⁶及びR⁷はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子等を表し、

R⁸及びR⁹はそれぞれ独立して水素原子、C₁—C₈アルキル基等を表す。]

で示される化合物及びこれらの塩、ならびに該化合物を有効成分として含む農薬及び除草剤。

明細書

ピリミジノン誘導体及び除草剤

技術分野

本発明は新規なピリミジノン誘導体及びそれを有効成分として含有する除草剤に関するものである。

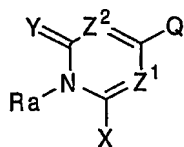
技術背景

ピリミジノン環の特定の位置に、置換フェニル基が結合した本願発明の化合物群が除草作用を示すことは従来全く知られていない。

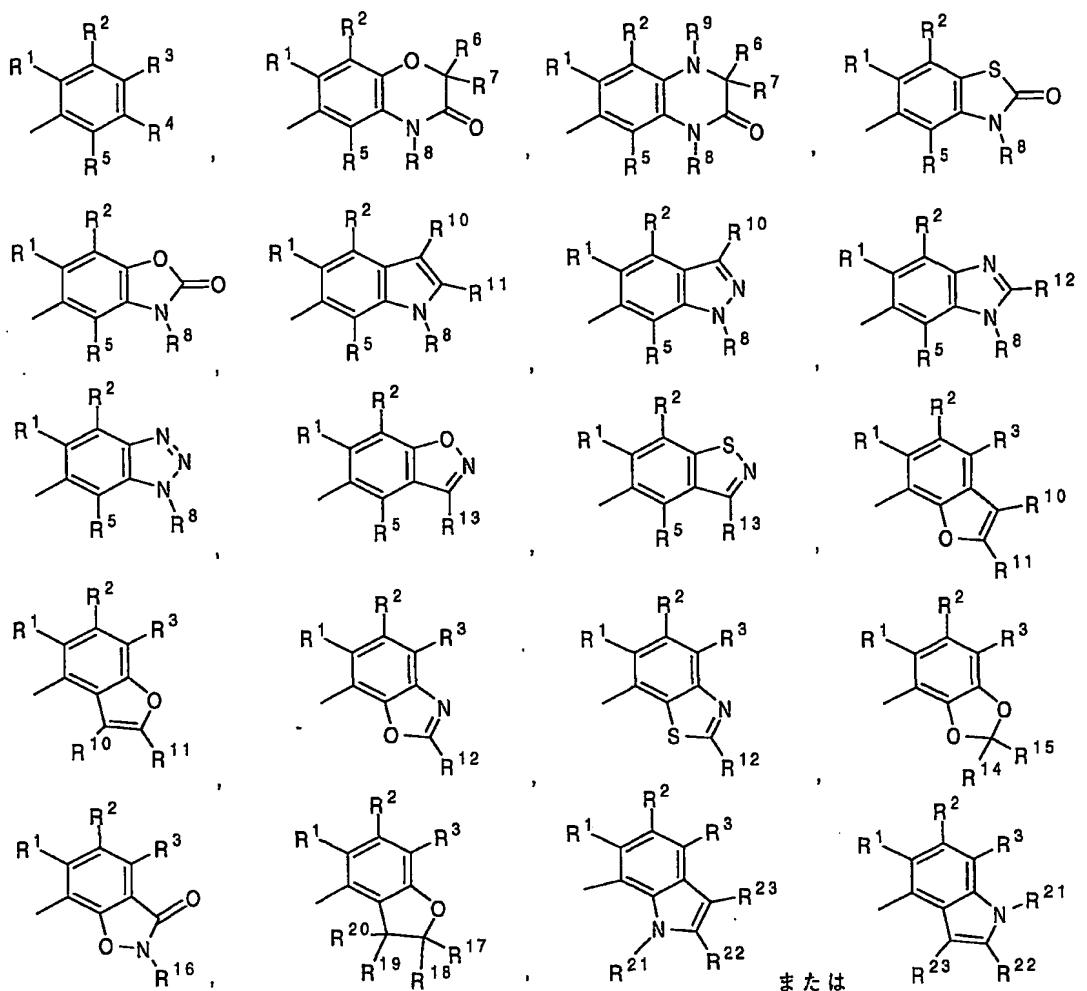
発明の開示

本発明者らは新規なピリミジノン誘導体の除草作用について鋭意検討した結果、下記式で示される化合物が優れた除草作用を有することを見出し本発明を完成するに至った。すなわち、本発明は〔１〕～〔６〕に関する。

〔１〕式（１）：



〔式中、Q－は式（２）：



を表し、

R a は水素原子、シアノ基、C₁—C₄アルキル基、シアノ C₁—C₄アルキル基、C₁—C₄アルコキシ C₁—C₄アルキル基、C₁—C₄アルキルチオ C₁—C₄アルキル基、C₁—C₄ハロアルキル基、C₁—C₄アルキルスルホニル基、(C₁—C₄アルキル)カルボニル基または(C₁—C₄アルコキシ)カルボニル基を表し、

X は水素原子、C₁—C₄アルキル基、C₁—C₄ハロアルキル基、C₁—C₄アルコキシ基、C₁—C₄ハロアルコキシ基、C₁—C₄アルキルチオ基、C₁—C₄アルキルスルホニル基、アミノ基、C₁—C₄アルキルアミノ基、または(C₁—C₄アルキル)₂アミノ基を表し、

Y は酸素原子または硫黄原子を表し、

Z¹およびZ²はそれぞれ独立して窒素原子またはCRbを表し、但し、Z¹が窒素原子を表すときはZ²はCRbを表し、Z¹がCRbを表すときはZ²は窒素原子を表し、

Rbは水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₄アルコキシ基、C₁-C₄ハロアルコキシ基またはシアノ基を表し、

R¹およびR²はそれぞれ独立しては水素原子またはハロゲン原子を表し、

R³は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基、アミノ基、ホルミル基、カルボキシル基、シアノメチル基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、スルファモイル基、チオカルバモイル基、カルバモイル基、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシ基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄ハロアルコキシ基、C₁-C₄アルキルチオ基、C₁-C₄アルキルスルホニル基、C₁-C₄アルコキシC₁-C₄アルキル基、C₁-C₄アルコキシC₁-C₄アルコキシ基、C₂-C₈アルケニル基、C₂-C₈アルキニル基、トリメチルシリルエチニル基、C₁-C₄アルキルアミノ基、(C₁-C₄アルキル)₂アミノ基、置換フェニル基、置換フェニルカルボニル基、置換フェニルカルボニルオキシ基、置換フェニルメチル基、置換フェニルスルホニル基、置換フェニル-L-O、置換フェニル-L-NH、置換フェニル-L-SまたはC₁-C₄アルキルOC(O)-L-Oを表し、

R⁴は水素原子、ハロゲン原子、ホルミルアミノ基、シアノ基、クロロスルホニル基、ニトロ基、ヒドラジノ基、置換フェニル基、1,3-ジオキサラン-2-イル基、1,3-ジオキササン-2-イル基、C₁-C₈アルキル基、C₃-C₈シクロアルキル基、C₂-C₈アルケニル基、C₂-C₈アルキニル基、C₁-C₈ハロアルキル基、C₃-C₈ハロゲノシクロアルキル基、C₂-C₈ハロアルケニル基、C₂-C₈ハロアルキニル基、(C₁-C₆アルキル)カルボニル基、(C₁-C₆ハロアルキル)カルボニル基、R³⁰O、R³⁰-L-O、R³⁰C(O)-L-O、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、2-ピリミジニルオキシ基、2-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基、5-クロロ-2-ピリジルオキシ基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジル

オキシ基、 $R^{30}S$ 、 $R^{30}NH$ 、 $R^{31}OC(O)$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)$ 、 $R^{33}SO_2NHC(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L$ 、 $R^{30}C(O)$ 、 $R^{30}-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)-L-NH$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-NH$ 、 $R^{30}C(O)-L-NH$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L-SO_2$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-S$ 、 $R^{30}C(O)-L-S$ 、 $R^{34}SO_2NH$ 、 $(R^{34}SO_2)_2N$ 、 $R^{34}SO_2(R^{35})N$ 、 $R^{36}OC(O)NH$ 、 $R^{36}OC(O)(R^{35})N$ 、 $R^{31}OC(O)-L-(R^{35})N$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-(R^{35})N$ 、置換フェニル $(R^{35})N$ 、 $R^{30}R^{35}N$ 、 $R^{36}CONH$ 、 $R^{36}C(O)(R^{35})N$ 、 $R^{37}ON=CH$ 、 $(C_1-C_4\text{アルコキシ})_2P(O)-L$ 、 $R^{30}O-L$ 、 $R^{30}S-L$ 、 $R^{30}NH-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L$ 、 $R^{30}S(O)-L$ 、 $R^{30}SO_2-L$ 、 $NC-L$ 、 $R^{30}CO_2-L$ 、 $R^{30}C(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NCO_2$ 、 $(R^{38}O)R^{31}NC(O)-L$ 、 $(2\text{-クロロ-4-ブタノリド-2-イル})C_1-C_4\text{アルキル基}$ 、 $R^{38}-O-N=C(R^{37})-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)C_1-C_4\text{アルキレン-O-C(=NOR}^{38})-L$ 、 $R^{30}C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{30}-O-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-S$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})$ 、 $R^{31}R^{32}NC(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NNR^{31}R^{32})-L$ 、 $(C_1-C_4\text{アルキル})_3Si-L-O$ 、 $(C_1-C_4\text{アルキル})_3Si-L-O-CH_2-O$ または置換されていてもよい5～6員のヘテロ環を表し、

R^5 は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシ基、メルカプト基、 $C_1-C_4\text{アルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルケニル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルキニル基}$ 、 $C_1-C_4\text{アルコキシ基}$ 、 $C_1-C_4\text{ハロアルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルケニルオキシ基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルキニルオキシ基}$ 、2,3-エポキシ-2-メチルプロピル基または2-メチル-2-プロペニル基を表し、

R^6 および R^7 はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6\text{アルキル基}$ 、シアノ基または $C_1-C_6\text{ハロアルキル基}$ を表し、

R^8 および R^9 はそれぞれ独立して水素原子、 $C_1-C_8\text{アルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルケニル基}$ 、 $C_2-C_8\text{アルキニル基}$ 、 $C_1-C_8\text{ハロアルキル基}$ 、 $C_2-C_8\text{ハロア}$

ルケニル基、 C_2-C_8 ハロアルキニル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル基、ホルミル基、ベンゾイル基、フェナシル基、 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 $NC-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L$ 、 $R^{39}OC(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(=OR^{38})-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-O$ 、 $R^{39}OC(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(=OR^{38})-L-O$ または置換フェニル $-L$ を表し、

R^{10} は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基または (C_1-C_4) アルキルカルボニル基を表し、

R^{11} は水素原子、ホルミル基、カルボキシ基、ヒドロキシメチル基、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルチオ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル C_1-C_4 アルキル基、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基、 (C_1-C_4) アルキルアミノカルボニル基、 C_1-C_4 アルキル $-CH(OH)$ 、 C_2-C_4 アルケニル $-CH(OH)$ 、 C_3-C_8 シクロアルキル $-CH(OH)$ または (C_3-C_8) シクロアルキルカルボニル基を表し、

R^{12} は水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基または C_1-C_4 アルコキシ (C_1-C_4) アルキル基を表し、

R^{13} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基または置換フェニル基を表し、

R^{14} および R^{15} はそれぞれ独立して水素原子または C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{16} は水素原子または C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} および R^{20} はそれぞれ独立して水素原子または C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{21} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基

、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 ハロアルキルスルホニル基または C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基を表し、

R^{22} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、ヒドロキシ C_1-C_4 アルキル基または C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基を表し、

R^{23} は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ニトロ基、アミノ基、シアノ基、ホルミル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_4 ハロアルキル)カルボニル基、カルボキシル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、ヒドロキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、 $R^{38}ON=CH$ または $R^{38}ON=C$ (C_1-C_4 アルキル)を表し、

R^{30} は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_8 ハロアルキル基、 C_2-C_8 ハロアルケニル基、 C_2-C_8 ハロアルキニル基、4-ブタノリド-2-イル基、5-ペンタノリド-2-イル基、6-ヘキサノリド-2-イル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、(C_1-C_4 アルキル) $_2$ アミノカルボニル基、 C_3-C_8 シクロアルケニル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロフラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)メチル基、(C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル) $_2$ C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロピラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、(フラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_2-C_8 アルキニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ C_1-C_4 アルキル基、置換フェニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、置換フェニル C_2-C_8 アルキニル基、置換フェニル C_2-C_8 アルケニル基、シアノ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルチオ C_1-C_4 アルキル基、ベンジルオキシメチル基、テトラヒドロピラン-2-イル基、オキシラニル基、オキシラニルメチル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、(C_1-C_8 アルキル)カルボニル基、シアノ C_2-C_8 アルケニル基、(C_1-C_4 ハロアルキル)カルボニル基

、置換フェニル基、(テトラヒドロフラン-3-イル) C_1-C_4 アルキル基、(3-メチルオキセタン-3-イル) C_1-C_4 アルキル基、(2-ピロリドン-1-イル) C_1-C_4 アルキル基、(C_2-C_8 アルケニル)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル)カルボニル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、 C_1-C_8 アルキルスルホニル基、 C_1-C_8 ハロアルキルスルホニル基、(C_1-C_4 アルキル)カルボニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 ハロアルコキシ)カルボニル基、(置換されていてもよい5から6員ヘテロ環) C_1-C_4 アルキル基、テトラヒドロピラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-4-イル基、(テトラヒドロピラン-3-イル) C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロピラン-4-イル) C_1-C_4 アルキル基または1-メチルピロリジン-3-イル基を表し、

R^{31} は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、オキセタン-3-イル基、 C_1-C_4 アルキルアミノ基、(C_1-C_4 アルキル) $_2$ アミノ基、 C_1-C_4 アルキリデンイミノ基、置換されていてもよいフェニル基、ベンジル基、(C_2-C_8 アルケニル)オキシカルボニル C_1-C_4 アルキル基、(C_2-C_8 アルキニル)オキシカルボニル C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロフラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 アルキル) $_2$ アミノ C_1-C_4 アルキル基、置換されていてもよい5から6員ヘテロ環、 C_2-C_6 ハロアルケニル基または C_1-C_4 アルキルチオ C_1-C_4 アルキル基を表し、

R^{32} は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基または C_1-C_6 ハロアルキル基を表し、但し、 R^{31} と R^{32} は結合している窒素原子とともに C_1-C_4 アルキル基で置換されていてもよい3から8員のヘテロ環を表していてもよく、そのときのヘテロ環の構成要素は炭素、酸素、硫黄および窒素原子から任意に選択され、

R^{33} は C_1-C_4 アルキル基または C_1-C_4 ハロアルキル基を表し、

R^{34} は C_1-C_8 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキ

ル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ベンジル基またはフェニル基を表し、

R^{35} は C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_2-C_8 ハロアルケニル基、 C_2-C_8 ハロアルキニル基、シアノ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキル基、ホルミル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_6 ハロアルキル)カルボニル基または置換フェニルカルボニル基を表し、

R^{36} は C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、置換フェニル基または置換フェニル C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{37} は C_1-C_6 アルキル基または(C_1-C_3 アルコキシ)カルボニル C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{38} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基またはベンジル基を表し、

R^{39} は C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_6 アルコキシ)カルボニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基または(C_1-C_4 アルコキシ) $_2P(O)$ を表し、

Lは飽和あるいは不飽和の分岐していてもよく、ハロゲン原子、シアノ基または(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基によって置換されていてもよい C_1-C_6 のアルキレン鎖を表し、

置換フェニルはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル基、ヒドロキシ基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、(C_1-C_4 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキルオキシ基、 $OCH(CH_3)CO_2H$ 、 OCH_2CO_2H 、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ基、(C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルコキシ基、(C_1-C_4 アルケニルオキシ C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルコキシ基、(C_1

—C₄アルキニルオキシC₁—C₄アルコキシ)カルボニルC₁—C₄アルコキシ基または(C₁—C₄ハロアルコキシC₁—C₄アルコキシ)カルボニルC₁—C₄アルコキシ基によって任意に置換されていてもよいフェニル基を表し、

置換されていてもよい5から6員ヘテロ環はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル基、ヒドロキシ基、C₁—C₄アルキル基、C₁—C₄アルコキシ基、C₁—C₄ハロアルキル基、C₁—C₄ハロアルコキシ基、C₁—C₄アルキルスルホニル基、(C₁—C₄アルキル)カルボニル基、(C₁—C₄アルコキシ)カルボニルC₁—C₄アルキルオキシ基、OCH(CH₃)CO₂H、OCH₂CO₂Hまたは(C₁—C₄アルコキシ)カルボニル基によって任意に置換されていてもよい5から6員ヘテロ環を表し、

但し、これらの化合物に光学活性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの混合物および単離された異性体の双方を包含する。)で示されるピリミジノン誘導体およびその塩。

[2] R_aがC₁—C₄アルキル基、C₁—C₄ハロアルキル基またはC₁—C₄アルキルスルホニル基を表し、

Xが水素原子、C₁—C₄アルキル基またはアミノ基を表し、

Yが酸素原子を表し、

Z¹が窒素原子を表し、

Z²がCR_bを表し、

R_bがハロゲン原子を表し、

R¹が水素原子またはフッ素原子を表し、

R²が水素原子を表す[1]記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

[3] Xがメチル基を表す[2]記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

[4] R_aがCHF₂またはCF₃を表す[2]記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

[5] [1]～[4]記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する農薬。

[6] [1]～[4]記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する除草剤。

発明を実施するための最良の形態

本発明化合物及び本発明化合物の合成中間体の置換基 R^a 、 R^b 、 X 、 Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 、 R^{21} 、 R^{22} 及び R^{23} を具体的に列記する。但し、記号はそれぞれ以下の意味を表す。

Me ：メチル、 Et ：エチル、 Pr ：ノルマルプロピル、 $iso-Pr$ ：イソプロピル、 $cyclo-Pr$ ：シクロプロピル、 Bu ：ノルマルブチル、 $sec-Bu$ ：セカンダリーブチル、 $iso-Bu$ ：イソブチル、 $tert-Bu$ ：ターシャリーブチル、 $cyclo-Bu$ ：シクロブチル、 Pen ：ノルマルペンチル、 $cyclo-Pen$ ：シクロペンチル、 $iso-Pen$ ：イソペンチル基、 $neo-Pen$ ：ネオペンチル基、 $cyclo-Hex$ ：シクロヘキシル、 $tert-Pen$ ：ターシャリーペンチル、 Hex ：ノルマルヘキシル、 Hep ：ノルマルヘプチル、 Oct ：ノルマルオクチル、 Ph ：フェニル基

〔置換基 R^a の具体例〕

CF_2H 、 CF_3 、 Me 、 Et 、 Pr 、 $iso-Pr$ 、 SO_2Me 、 CN 、 CH_2OMe 、 CH_2SMe 、 CH_2CN または CH_2CF_3

〔置換基 R^b の具体例〕

H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 CN 、 OMe 、 OCF_2H または OCF_3

〔置換基 X の具体例〕

H 、 Me 、 Et 、 Pr 、 $iso-Pr$ 、 CF_2H 、 NH_2 、 OMe 、 OEt 、 OPr 、 $O(iso-Pr)$ 、 OCF_2H 、 OCF_3 、 SMe 、 SEt 、 SPr 、 $S(iso-Pr)$ 、 SO_2Me 、 SO_2Et 、 SO_2Pr 、 $SO_2(iso-Pr)$ 、 $NHMe$ 、 $NHEt$ 、 $NHPr$ 、 $NH(iso-Pr)$ 、 NMe_2 、 NEt_2 、 NPr_2 または $N(iso-Pr)_2$

〔置換基 Y の具体例〕

O または S

〔置換基 R^1 及び R^2 の具体例〕

H 、 F 、 Cl 、 Br または I

〔置換基 R^3 の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、 $C\equiv N$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C\equiv CSiMe_3$ 、 $C\equiv CH$ 、 $CH=CH_2$ 、Me、Et、Pr、iso-Pr、OMe、OEt、 SO_2NH_2 、 OCH_2CO_2Me 、 OCH_2CO_2Et 、 $OCH_2CH_2CO_2Et$ 、 CF_3 、 CF_3CF_2 、 $ClCF_2$ 、 HCF_2 、 CF_3O 、 NO_2 、 HCF_2O 、 $ClCH_2$ 、 $BrCH_2$ 、SMe、 SO_2Me 、OH、SH、 NH_2 、CHO、 CO_2H 、 CO_2Me 、 CO_2Et 、 CO_2Pr 、 $CO_2(iso-Pr)$ 、 CO_2Bu 、 $CO_2(tert-Bu)$ 、 $CH_2C\equiv N$ 、NHMe、 NMe_2 、 OCH_2OMe 、 OCH_2Ph 、 $OCH_2(4-Cl-Ph)$ 、 $OCH_2(4-Me-Ph)$ 、 $OCH_2(4-Br-Ph)$ 、 $OCH_2(4-Cl-2-(OCHMeCO_2Me)-Ph)$ 、 $OCH_2(4-Me-2-(OCHMeCO_2Me)-Ph)$ 、 $OCH_2(4-Cl-2-(OCHMeCO_2Et)-Ph)$ 、 $OCH_2(4-Me-2-(OCHMeCO_2Et)-Ph)$ 、 $NHCH_2Ph$ 、 $NHCH_2(4-Cl-Ph)$ 、 $NHCH_2(4-Me-Ph)$ 、 $NHCH_2(4-Br-Ph)$ 、 $NHCH_2(4-Cl-2-(OCHMeCO_2Me)-Ph)$ 、 $NHCH_2(4-Me-2-(OCHMeCO_2Me)-Ph)$ 、 SCH_2Ph 、 $SCH_2(4-Cl-Ph)$ 、 $SCH_2(4-Me-Ph)$ 、 $SCH_2(4-Br-Ph)$ 、 $SCH_2(4-Cl-2-(OCHMeCO_2Me)-Ph)$ 、 $SCH_2(4-Me-2-(OCHMeCO_2Me)-Ph)$ 、 OCH_2CO_2Pr 、 $OCH_2CO_2(tert-Bu)$ 、 $NHCH_2CO_2Me$ 、 $NHCH_2CO_2Et$ 、 SCO_2Me または SCO_2Et

〔置換基R'の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、CHO、 CO_2H 、 $C(O)NH_2$ 、 SO_2Cl 、 $C(O)Me$ 、SH、OH、 NH_2 、 NO_2 、CN、Ph、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、cyclo-Pr、cyclo-Bu、cyclo-Pen、cyclo-Hex、 $CH_2CH=CH_2$ 、 $CH(Me)CH=CH_2$ 、 $CH_2C\equiv CH$ 、 $CH(Me)C\equiv CH$ 、OMe、OEt、O(iso-Pr)、OPr、OBu、O(sec-Bu)、O(tert-Bu)、O(iso-Bu)、O(cyclo-Pen)、O(cyclo-Pr)、O(cycl

$o\text{-Hex}$)、 $O(\text{neo-Pen})$ 、 $O(\text{tert-Pen})$ 、 $OPen$ 、 $OHex$ 、 $OHep$ 、 $OOct$ 、 OCH_2Ph 、 OPh 、 $O(4\text{-Cl-Ph})$ 、 $O(3\text{-Cl-Ph})$ 、 $O(2\text{-Cl-Ph})$ 、 $O(4\text{-Me-Ph})$ 、 $O(3\text{-Me-Ph})$ 、 $O(2\text{-Me-Ph})$ 、 $O(4\text{-MeO-Ph})$ 、 $O(3\text{-MeO-Ph})$ 、 $O(2\text{-MeO-Ph})$ 、 $OCH_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2CH=CHMe$ 、 $OCHMeCH=CH_2$ 、 $OCMe_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $OCHMeC\equiv CH$ 、 $OCMe_2C\equiv CH$ 、 $OCH_2CH=CClH$ 、 $OCH_2CCl=CH_2$ 、 $OCHMeCH_2CH=CH_2$ 、 $OCHMeCH_2C\equiv CH$ 、 CH_2CH_2OMe 、 OCH_2CH_2OEt 、 OCH_2CH_2OPr 、 OCH_2OMe 、 OCH_2OEt 、 OCH_2OCH_2Ph 、 $OCH_2O(\text{cyclo-Pen})$ 、 $OCH_2O(\text{cyclo-Bu})$ 、 $OCH_2O(\text{cyclo-Pr})$ 、 $OCH_2O(\text{tert-Bu})$ 、 $OCH_2O(\text{iso-Bu})$ 、 $OCH_2O(\text{sec-Bu})$ 、 OCH_2OPr 、 $OCH_2O(\text{iso-Pr})$ 、 OCH_2OBu 、 $OCH_2CH_2CH_2OMe$ 、 $OCH_2CH_2CH_2CH_2OMe$ 、 $OCH_2OCH_2CH_2SiMe_3$ 、 $OCH(Me)OMe$ 、 O -(テトラヒドロピラン-2-イル)、 O -(テトラヒドロピラン-3-イル)、 O -(テトラヒドロピラン-4-イル)、 O -(テトラヒドロフラン-2-イル)、 O -(テトラヒドロフラン-3-イル)、 O -オキシラニル、 $OCH_2(\text{cyclo-Pr})$ 、 $OCH_2(\text{cyclo-Bu})$ 、 $OCH_2(\text{cyclo-Pen})$ 、 $OCH_2(\text{cyclo-Hex})$ 、 $OCH_2(1, 5\text{-ジメチルピラゾール-1-イル})$ 、 O -(2, 3-エポキシプロピル)、 $OCH_2CMe=CH_2$ 、 $OCH_2OCH_2CH_2OMe$ 、 $OCH_2CH_2C\equiv CH$ 、 OCH_2 (テトラヒドロフラン-2-イル)、 $OCH_2(2, 2\text{-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル})$ 、 $OCH(CH_2OEt)_2$ 、 OCH_2 (テトラヒドロピラン-2-イル)、 OCH_2 (フラン-2-イル)、 OCH_2 (フラン-3-イル)、 OCH_2 (テトラヒドロフラン-3-イル)、 $OCH_2(3\text{-メチルオキサタン-3-イル})$ 、 $OCHMe(\text{cyclo-Pr})$ 、 $OCH_2CH_2OCH=CH_2$ 、 $OCH_2C\equiv CMe$ 、 $OCH_2CH_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2CH_2C\equiv CMe$ 、 $OCH_2CH_2CH_2C\equiv CH$ 、 $OCH_2CH_2CMe=CH_2$ 、 $OCH_2CH_2CH_2CH=CH_2$ 、 OCH_2CH_2SMe 、 $OCH_2CH_2OC(O)Me$ 、 OCH_2CH

₂ (モルホリン-1-イル)、OCH₂CH₂ (ピロリジン-1-イル)、OCH₂CH₂ (2-ピロリドン-1-イル)、O- (2-シクロヘキセン-1-イル)、OCH₂CH₂OCH₂CH₂Cl、OCH₂CH₂OCH₂CH=CH₂、OCH₂CH₂OPh、OCH₂EtC≡CH、OCH₂PrC≡CH、OCH (iso-Bu) C≡CH、OCH₂PhC≡CH、OCH₂BuC≡CH、OCH (iso-Pr) C≡CH、OCH (CHMePr) C≡CH、OCH₂C≡CPh、OCH₂C≡CCH₂OMe、OCHMeC≡CEt、OCH₂CH=C (Me)₂、OCH₂CHMeCH=CH₂、OCH₂CH₂OCH₂C≡CH、OCH₂EtCH₂OCH₂CH=CH₂、OCHMeCH₂OEt、OCHMeCH₂OPr、OCHMeCH₂OCH₂CH=CH₂、OCHMeCH₂OCH₂CH=CHMe、OCH (CH₂Cl) CH₂O (iso-Pr)、OCH (CH₂Cl) CH₂OCH₂CH=CH₂、OCHMeCH₂OCH₂CH=CHCl、OCHMeCH₂OCHClCH=CH₂、OCHMeCH₂OCH₂CH₂OMe、OCHBrCH₂OEt、OCH (CH₂OCH₂CH=CH₂)₂、OCH₂EtCH₂CH₂OEt、O (1-メチルピロリジン-3-イル)、OCH₂C≡CCH₂Cl、OCH₂CH₂O (2-Cl-Ph)、OCH₂CH₂OCH₂CH₂OMe、OCH₂EtCH₂OMe、OCH (CH₂F)₂、OCH₂CH₂OCH₂CH₂OCH₂CH₂Cl、OCH₂CHMeOPh、OCHMeCH₂OCMe₃、OCHMeCH₂OMe、OCH₂CH₂CH₂OEt、OCH₂EtCH=CH₂、OCH₂CH₂CH₂Cl、OCHMeCH₂OPh、OCHMeCH=CH₂、OCHMeCH=CHMe、OCH (CH=CH₂)₂、OCH₂CHClCH₂Cl、OCH₂CH₂CH₂Br、OCH (CH₂Cl)₂、OCH (CH₂Br)₂、OCHMeCH₂Cl、OCH₂CH₂F、OCH₂CHF₂、OCH₂CF₃、OCH (CF₃)₂、OCH₂CH₂CN、OCH₂CH₂Br、OCH₂CH₂CO₂Me、OCH₂CH₂CO₂Et、OCH₂PhCO₂Me、OCH₂PhCO₂Et、OCH₂CH₂NMe₂、OCH₂CH₂SO₂Me、OCH₂CH₂CH₂SMe、OCH₂CH₂CH₂S (O) Me、OCH₂CH₂CH₂SO₂Me、OCH₂C (O) Me、OCH₂CH₂ (オキシラニル)、O- (ピリミジン-2-イル)、O- (4-ブタノリド-2-イル)、O- (2, 3-エポキシプロピル)、OCH₂CN、OCHMeCN、OC (O) Me、OC (

$O) \cdot Et$, $OC(O)Pr$, $OC(O)(iso-Pr)$, $OC(O)CH=CHMe_2$, $OC(O)CH_2Cl$, $OC(O)CH_2CCl_3$, $OC(O)$ (モルホリン-1-イル), $OC(O)CH_2OMe$, OCO_2Me , OCO_2Et , OCO_2Pr , $OCO_2iso-Pr$, OCO_2Ph , $OC(O)NH_2$, $OC(O)NMe_2$, $OC(O)NEt_2$, $OC(O)NPr_2$, $OCH_2CH=CH_2$, $O(iso-Pen)$, SMe , SEt , $S(iso-Pr)$, SPr , SBu , $S(sec-Bu)$, $S(iso-Bu)$, $S(cyclo-Pen)$, $S(cyclo-Pr)$, $S(cyclo-Hex)$, $S(neo-Pen)$, $S(tert-Pen)$, $SPen$, $SHex$, $SHep$, $SOct$, $SCH_2CH=CH_2$, $SCHMeCH=CH_2$, $SCMe_2CH=CH_2$, $SCH_2C\equiv CH$, $SCHMeC\equiv CH$, $SCMe_2C\equiv CH$, $SCH_2CH=CClH$, $SCH_2CCl=CH_2$, SCH_2CF_3 , SCH_2CH_2OMe , SCH_2CH_2OEt , SCH_2OMe , SCH_2OEt , $SCH_2(cyclo-Pr)$, SCH_2CN , $NHMe$, $NHEt$, $NH(iso-Pr)$, $NHPr$, $NHBu$, $NH(sec-Bu)$, $NH(iso-Bu)$, $NH(cyclo-Pen)$, $NH(cyclo-Pr)$, $NH(cyclo-Hex)$, $NH(neo-Pen)$, $NH(tert-Pen)$, $NHPen$, $NHHex$, $NHHep$, $NHOct$, $NHCH_2CH=CH_2$, $NHCHMeCH=CH_2$, $NHCHMe_2CH=CH_2$, $NHCH_2C\equiv CH$, $NHCHMeC\equiv CH$, $NHCHMe_2C\equiv CH$, $NHCH_2CH=CClH$, $NHCH_2CCl=CH_2$, $NHCH_2CF_3$, $NHCH_2CH_2OMe$, $NHCH_2CH_2OEt$, $NHCH_2OMe$, $NHCH_2OEt$, $NHCH_2(cyclo-Pr)$, $NHCH_2CN$, CO_2Me , CO_2Et , $CO_2(iso-Pr)$, CO_2Pr , $CO_2(cyclo-Pr)$, CO_2Bu , $CO_2(sec-Bu)$, $CO_2(iso-Bu)$, $CO_2(tert-Bu)$, $CO_2(cyclo-Bu)$, CO_2Pen , $CO_2(cyclo-Pen)$, CO_2Pen , $CO_2(neo-Pen)$, $CO_2(tert-Pen)$, CO_2Hex , $CO_2(cyclo-Hex)$, CO_2Hep , CO_2Oct , $CO_2CH_2CH=CH_2$, $CO_2CHMeCH=CH_2$, $CO_2CMe_2CH=CH_2$, $CO_2CH_2C\equiv CH$, $CO_2CHMeC\equiv CH$, $CO_2CMe_2C\equiv CH$, $CO_2CMe_2CO_2CH_2CH=CH_2$, CO_2CM

$e_2CO_2CHMeCH=CH_2$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CMe_2CH=CH_2$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CH_2C\equiv CH$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CHMeC\equiv CH$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CMe_2C\equiv CH$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CH_2CH_2C\equiv CH$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CH_2CH_2CH=CH_2$ 、 $CO_2CMe_2CO_2CH_2CH=CH_2$ 、 CO_2CH_2OMe 、 CO_2CH_2OEt 、 $CONMe_2$ 、 $CONEt_2$ 、 $CO_2CH_2CO_2Me$ 、 $CO_2CH_2CO_2Et$ 、 $CO_2CH_2CO_2Pr$ 、 $CH_2CHClCO_2Me$ 、 $CH_2CMeClCO_2Me$ 、 $CH_2CHClCO_2Et$ 、 $CH_2CMeClCO_2Et$ 、 $CH_2CHBrCO_2Me$ 、 $CH_2CHClSO_2Ph$ 、 $CH_2CHClSO_2Me$ 、 $CH_2CHClC(O)Me$ 、 $CH_2CHClCO_2H$ 、 $CH_2CHClCO_2(iso-Pr)$ 、 $CH_2CHClCO_2(cyclo-Hex)$ 、 $CH_2CHClCO_2(tert-Bu)$ 、 $CH_2CHClCO_2(iso-Bu)$ 、 $CH_2CHClCO_2Bu$ 、 $CH_2CHClCO_2(sec-Bu)$ 、 $CH_2CHClCO_2Pr$ 、 $CH_2CHClCO_2CH_2$ (テトラヒドロフラン-2-イル)、 $CH_2CHClC(O)$ (モルホリン-1-イル)、 $CH_2CHClC(O)NH_2$ 、 $CH_2CMeClC(O)NH_2$ 、 $CH_2CMeClC(O)NMe_2$ 、 $CH_2CHClCO_2CH(CF_3)_2$ 、 $CH_2CHClCO_2CH_2CF_3$ 、 $CH_2CHClCO_2CH_2CH_2OMe$ 、 $CH_2CHClCONHOMe$ 、 $CH_2CHClC(O)NHMe$ 、 $CH_2CHClC(O)NHEt$ 、 $CH_2CHClC(O)NH(iso-Pr)$ 、 $CH_2CHClC(O)NH(iso-Bu)$ 、 $CH_2CHClC(O)NH(sec-Bu)$ 、 $CH_2CHClC(O)NH(tert-Bu)$ 、 $CH_2CHClC(O)NH(cyclo-Pr)$ 、 $CH_2CHClC(O)NH(cyclo-Hex)$ 、 $CH_2CHClC(O)NHCH_2C\equiv CH$ 、 $CH_2CHClC(O)NHCH_2CH_2OMe$ 、 $CH_2CHClC(O)NHCH_2CH_2NMe_2$ 、 $CH_2CHClC(O)NHCH_2CO_2Et$ 、 $CH_2CHClC(O)NHCH(iso-Pr)CO_2Me$ 、 $CH_2CHClC(O)NHNMe_2$ 、 $CH_2CHClC(O)NH$ (モルホリン-1-イル)、 $CH_2CHClC(O)NHPh$ 、 $CH_2CHClC(O)NH$ (チアゾール-2-イル)、 $CH_2CHClC(O)NH$ (5-メチルイソキサゾール-3-イル)、 $CH_2CHClC(O)NHCH_2Ph$ 、 $CH_2CHClC(O)NMe_2$ 、 $CH_2CHBrC(O)NMe_2$ 、 CH_2

CHClC(O)NMeBu 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NMe(iso-Bu)}$
 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NMeOMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NEt}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NEtPr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NEt(iso-Pr)}$
 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NEtBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NEt(tert-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(iso-Pr)}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NPr(sec-Bu)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(CH}_2\text{CH=CH}_2)_2$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(CH}_2\text{CH}_2\text{Cl)}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(iso-Pr)(cyclo-Hex)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(CH}_2\text{CH=CH}_2)(\text{cyclo-Hex})$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(CH}_2\text{CH=CH}_2)(\text{cyclo-Pen})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NMePh}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NMe(ピリジン-2-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(ピロリジン-1-イル)}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(チオモルホリン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(4-メチルピペラジン-1-イル)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)N(cyclo-Hex)Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(O)NMeCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CMe(=NOMe)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH(=NOMe)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CH=CH}_2$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CHMeCH=CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2(\text{cyclo-Pr})$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CHClCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CH=CMeCl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、
 CH_2CHClCN 、 $\text{CH}_2\text{CCl}_2\text{CN}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C(O)NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHMeCO}_2\text{Me}$ 、
 $\text{CH}_2(2\text{-クロロブタノリド-2-イル})$ 、 $\text{CH=CHCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH=CHCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、
 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{CHF}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHF}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHF}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCHF}_2\text{CO}_2\text{Bu}$ 、
 $\text{OCHF}_2\text{CO}_2\text{Ph}$ 、 CHClCO_2Me 、 $\text{OCHClCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHClCO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCClFCO}_2\text{Bu}$ 、 CHBrCO_2Me 、 $\text{OCHBrCO}_2\text{Et}$ 、
 $\text{OCHBrCO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCHBrCO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{OCF}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCF}_2\text{CO}_2\text{Et}$

t 、 $\text{OCF}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCF}_2\text{CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{OCCl}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCCl}_2\text{CO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2(\text{tert}-\text{Bu})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Ph}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Hex}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2(\text{cyclo}-\text{Pen})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2(\text{iso}-\text{Pr})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2(\text{iso}-\text{Pr})$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2(\text{cyclo}-\text{Pen})$ 、 $\text{O}-(4\text{-ブタノリド}-2\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(5\text{-ペンタノリド}-2\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(6\text{-ヘキサノリド}-2\text{-イル})$ 、 $\text{OCH}(\text{CO}_2\text{Me})_2$ 、 $\text{OCH}(\text{CO}_2\text{Et})_2$ 、 $\text{OCH}(\text{CO}_2\text{Pr})_2$ 、 $\text{OCH}(\text{CN})\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}(\text{CN})\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCMe}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCMe}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NEt}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (モルホリン-1-イル)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NMe}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NMe}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (ピロリジン-1-イル)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (ピペリジン-1-イル)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{Pr}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (4-Cl-Ph)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (4-Br-Ph)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (3-Cl-Ph)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (3-Br-Ph)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (2-Cl-Ph)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})$ (2-Br-Ph)、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{Ph}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{Ph}$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Cl-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(3\text{-Cl-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(2\text{-Cl-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(2\text{-CF}_3\text{-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-F-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(3\text{-F-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(2\text{-F-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Me-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(3\text{-Me-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(2\text{-Me-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-MeO-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(3\text{-MeO-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(2\text{-MeO-Ph})$ 、 OSO_2Me 、 OSO_2CF_3 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Hex}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2(\text{cyclo}-\text{Pen})$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2(\text{iso}-\text{Pr})$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 SCH

MeCO_2Me 、 $\text{SCHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{SCHMeCO}_2\text{Pr}$ 、 SCHMeCO_2
 (iso-Pr) 、 $\text{SCHMeCO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{SCHMeCO}_2(\text{cyclo-Pen})$ 、 $\text{SOCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{SOCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Hex}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2(\text{cyclo-Pen})$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{NHCHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{NHCHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NHCHMeCO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{NHCHMeCO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{NHCHMeCO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{NHCHMeCO}_2(\text{cyclo-Pen})$ 、 NHCO_2Me 、 NHCO_2Et 、 NHCO_2Pr 、 $\text{NHCO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 NHCO_2Bu 、 $\text{NHCO}_2(\text{cyclo-Pr})$ 、 $\text{NHCO}_2(\text{cyclo-Pen})$ 、 $\text{NHCO}_2(\text{iso-Bu})$ 、 $\text{NHCO}_2(\text{sec-Bu})$ 、 $\text{NHCO}_2(\text{tert-Bu})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_3$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 NHCO_2Ph 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(2\text{-Me-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(3\text{-Me-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-Me-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-Et-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(2\text{-MeO-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(3\text{-MeO-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-MeO-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-Cl-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-F-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(2\text{-F-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(3\text{-F-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(3\text{-Cl-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(2\text{-Cl-Ph})$ 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2(4\text{-CF}_3\text{O-Ph})$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CHCl}_2$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Ph}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Et})\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{OMe})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NMe}\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Me})_2$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Et})_2$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Pr})_2$ 、 $\text{NEt}\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NMe}\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NEt}\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{Pr})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{OMe})\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{O})$

Et) SO₂Me、N(CH₂CH=CH₂) SO₂Me、N(CH₂C≡CH) SO₂Me、CONHSO₂Me、CONHSO₂Et、CONHSO₂CF₃、1, 3-ジオキソラン-2-イル、1, 3-ジオキサン-2-イル、4-(EtOC(O)CH₂CH₂O)-PhO、4-(MeOC(O)CH₂CH₂O)-PhO、NMeCO₂Me、N(CH₂C≡CH)CO₂Me、NMeC(O)Me、NHCHO、NHC(O)CF₃、NHC(O)Et、NHC(O)Me、NHCOPr、N(CH₂C≡CH)COMe、N(CH₂CH=CH₂)CO₂Me、NMeCO₂CH₂(4-Me-Ph)、N(CH₂C≡CH)CO₂Et、N(CH₂CN)CO₂Me、N(C(O)(tert-Bu))SO₂Me、N(C(O)(tert-Bu))SO₂Et、N(C(O)(2-MeO-Ph))SO₂Me、N(C(O)(3-MeO-Ph))SO₂Me、N(C(O)(4-MeO-Ph))SO₂Me、N(C(O)(2-MeO-Ph))SO₂Et、N(C(O)(3-MeO-Ph))SO₂Et、N(C(O)(4-MeO-Ph))SO₂Et、N(C(O)(4-Me-Ph))SO₂Me、N(C(O)(4-Me-Ph))SO₂Et、N(C(O)(4-Cl-Ph))SO₂Me、N(C(O)(4-Cl-Ph))SO₂Et、CO₂(オキセタン-3-イル)、N(CHO)CH₂CO₂Me、N(CHO)CH₂CO₂Et、N(CHO)CH₂CO₂Pen、N(CHO)CHMeCO₂Me、N(CHO)CHMeCO₂Et、N(C(O)Me)CH₂CO₂Me、N(C(O)Me)CH₂CO₂Et、N(C(O)Me)CH₂CO₂Pen、N(C(O)Me)CHMeCO₂Me、N(C(O)Me)CHMeCO₂Et、N(CH₂CN)SO₂Me、N(SO₂Me)CH₂CO₂Me、N(SO₂Me)CH₂CO₂Et、N(SO₂Et)CH₂CO₂Me、N(SO₂Et)CH₂CO₂Et、CF₃、CF₂H、CH₂Cl、CH₂Br、CHBr₂、CH₂OH、CHBrEt、CH₂CHClCH₂Cl、CH(OH)CH=CH₂、CH(OH)C≡CH、CH₂CHClOC(O)Me、CH(CO₂Me)₂、CH(CO₂Et)₂、CH(CN)CO₂Me、CH(CN)CO₂Et、CH₂CN、CH₂CH₂CN、CH=CHCN、CM_e₂CN、CH₂NMe₂、CH₂NEt₂、CH₂NPr₂、CH₂SMe、CH₂SEt、CH₂SPr、CH₂SCH₂C≡CH、CH₂SCH₂CH=CH₂、CH₂

SO_2Me 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 CH_2OMe 、 CH_2OEt 、 CH_2OPr 、 $\text{CH}_2\text{O}(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Pr}$ 、 $\text{C}(\text{O})(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OMe})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OEt})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OPr})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHEt}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHPr}$ 、 $\text{CH}=\text{CClCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}=\text{CClCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClP}(\text{O})(\text{OMe})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClP}(\text{O})(\text{OEt})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 OCH_2SMe 、 OCF_3 、 OCF_2H 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}(\text{CN})\text{CH}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CMe}=\text{CH}_2$ 、 OPh 、 $\text{O}-(\text{ピリジン}-2\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(\text{ピリジン}-4\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(5\text{-CF}_3\text{-3-Cl-ピリジン}-2\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(5\text{-CF}_3\text{-ピリジン}-2\text{-イル})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Me-2-(MeOC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Cl-2-(MeOC(O)CHMeO)-Ph})$ 、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、2-ピリミジニルオキシ、2-ピリジルオキシ、4-ピリジルオキシ、5-クロロ-2-ピリジルオキシ、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、3-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ、 $\text{OCH}_2(4\text{-(MeOCH}_2\text{O)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(MeOCH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(EtOCH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(MeOCH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(EtOCH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(CH}_2=\text{CHCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(EtOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(MeOCH}_2\text{CHMeOC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(FCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(HC}\equiv\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{OC(O)CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OC(O)Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OC(O)Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)OC(O)NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC(=NOMe)O}$

SO₂Me、CH₂CHClC(=NOMe)OP(O)(OEt)₂、CH₂CHClC(=NNMe₂)OMe、CH₂CHClC(=NNMe₂)O(iso-Pr)、CH₂CHClC(=NNMe₂)OCH₂CO₂Me、CH₂CHClC(=NNMe₂)OC(O)Me、CH₂CHClC(=NSO₂Me)OMe、CH₂CHClC(=NOMe)NMe₂、C(=NOMe)OMe、C(=NOMe)O(iso-Pr)、C(=NOMe)OCH₂CO₂Me、C(=NOMe)OC(O)Me、C(=NOMe)OC(O)Et、C(=NOMe)OC(O)NMe₂、C(=NOMe)OSO₂Me、C(=NOMe)OP(O)(OEt)₂、C(=NOCH₂=CHCH₂)OMe、C(=NOCH₂CH₂SiMe₃)OMe、C(=NO(テトラヒドロピラン-2-イル))OMe、C(=NNMe₂)OMe、C(=NSO₂Me)OMe、C(=NOMe)NMe₂、2-ピリジル、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル、フラン-2-イル、チオフェン-2-イル、5-クロロチオフェン-2-イル、4-メチル-1,3-オキサゾール-2-イル、CH(CH₂Cl)CH₂OCH₂CH=CH₂またはCH₂CHClC(O)NMe(iso-Pr)

〔置換基R⁵の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、OH、NO₂、NH₂、CO₂H、SH、Me、Et、Pr、iso-Pr、CF₃、CF₂Cl、CF₂H、CH₂CH₂Cl、CH₂Cl、OMe、OEt、OPr、O(iso-Pr)、CH₂CMe=CH₂、CH₂CH=CH₂、CHMeCH=CH₂、CH₂C≡CH、CHMeC≡CH、OCH₂C≡CH、OCH₂C≡CMe、OCH₂C≡CEt、OCHMeC≡CH、OCHEtC≡CH、OCHPrC≡CH、OCHMeC≡CMe、OCHEtC≡CMe、OCHPrC≡CCH₃、OCHMeC≡CEt、OCHEtC≡CEt、OCHPrC≡CEt、2,3-エポキシ-2-メチルプロピル基または2-メチル-2-プロペニル基

〔置換基R⁶およびR⁷の具体例〕

H、F、Me、Et、CNまたはCF₃

〔置換基R⁸およびR⁹の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 CO_2Me 、 CO_2Et 、 CO_2Pr 、 $\text{CO}_2(\text{tert-Bu})$ 、 SO_2Me 、 SO_2Et 、 SO_2Pr 、 CH_2OMe 、 CH_2OEt 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CCl}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CBr}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CHMeC}=\text{CH}_2$ 、 OMe 、 OEt 、 OPr 、 $\text{H}(\text{Me})\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 CH_2CONH_2 、 CH_2CONHMe 、 $\text{CH}_2\text{CONMe}_2$ 、 CHMeCO_2Me 、 CHMeCO_2Et 、 $\text{CHMeCO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 CHMeCONH_2 、 CHMeCONHMe 、 CHMeCONMe_2 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{CHMeC}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CHMeC}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CHMeC}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CONH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CONHMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CONMe}_2$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHMeCO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 OCHMeCONH_2 、 OCHMeCONHMe 、 OCHMeCONMe_2 、 $\text{OCH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{OCHMeC}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{OCHMeC}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHMeC}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 OCH_2OCH_3 、 $\text{OCHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCHMeC}\equiv\text{CH}$ または $\text{OCHMeC}\equiv\text{N}$

〔置換基 R^{10} の具体例〕

H、Cl、Br、F、I、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、 CO_2Me 、 CO_2Et 、 CO_2Pr 、 $\text{CO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Pr}$ 、 $\text{C}(\text{O})(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Bu}$ 、 $\text{C}(\text{O})(\text{sec-Bu})$ 、 $\text{C}(\text{O})(\text{iso-Bu})$ 、 $\text{C}(\text{O})(\text{tert-Bu})$ または $\text{C}(\text{O})(\text{cyclo-Pr})$

〔置換基R¹¹の具体例〕

H、CHO、CO₂H、CH₂OH、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、CF₃、CF₂Cl、CF₂H、CH₂CH₂Cl、CH₂Cl、CHMeBr、CH₂Br、CHBr₂、CBr₃、CHMeCl、C(O)Me、C(O)Et、C(O)Pr、C(O)(iso-Pr)、C(O)Bu、C(O)(sec-Bu)、C(O)(tert-Bu)、C(O)(cyclo-Pr)、CH₂OMe、CH₂OEt、CH₂CH₂OMe、CH₂CH₂OEt、CHMeOEt、CHMeOMe、CH₂SMe、CH₂SEt、CH₂CH₂SMe、CH₂CH₂SEt、CHMeSEt、CHMeSMe、CH₂SO₂Me、CH₂CH₂SO₂Me、CO₂Me、CO₂Et、CO₂Pr、CO₂(iso-Pr)、C(O)NHMe、C(O)NHEt、C(O)NHPr、CH(OH)Me、CH(OH)Et、CH(OH)Pr、CH(OH)CH=CH₂、CH(OH)C≡CHまたはCH(OH)(cyclo-Pr)

〔置換基R¹²の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、NH₂、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、OMe、OEt、OPr、O(iso-Pr)、OBu、O(sec-Bu)、O(iso-Bu)、O(neo-Pen)、O(tert-Pen)、OPen、OHex、SMe、SEt、SPr、S(iso-Pr)、SBu、S(sec-Bu)、S(iso-Bu)、S(neo-Pen)、S(tert-Pen)、SPen、SHex、CH₂OMe、CH₂OEt、CH₂CH₂OMe、CH₂CH₂OEt、CHMeOEtまたはCHMeOMe

〔置換基R¹³の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-Me-Ph、3-Me-Ph、4-Me-Ph、2-MeO-Ph、3-MeO-Ph、4-MeO-Ph

〔置換基R¹⁴およびR¹⁵の具体例〕

H、F、Cl、Br、I、NH₂、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Penまたはtert-Pen

〔置換基R¹⁶の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Penまたはtert-Pen

〔置換基R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹およびR²⁰の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Penまたはtert-Pen

〔置換基R²¹の具体例〕

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、C(O)CF₃、C(O)Me、CO₂Me、CO₂Et、SO₂Me、SO₂CF₃またはCH₂OMe

〔置換基R²²の具体例〕

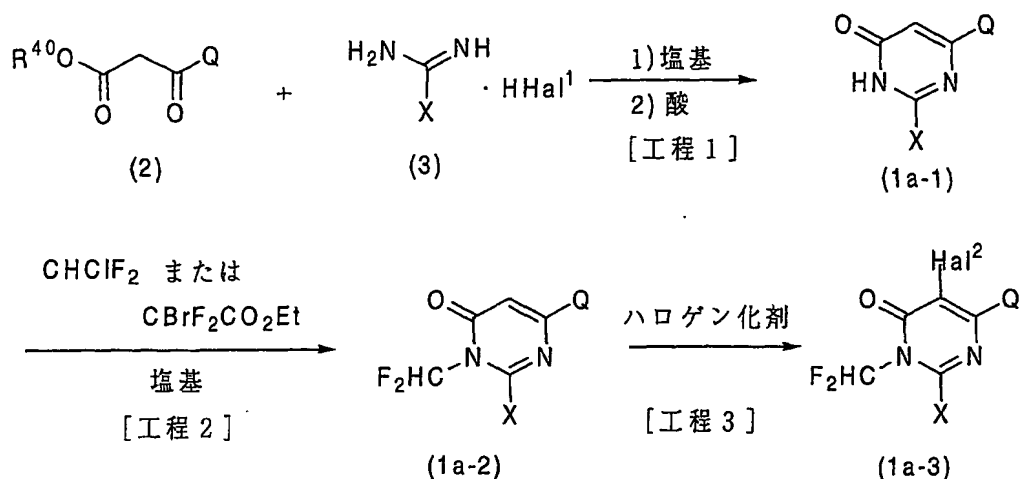
H、Me、Et、Pr、iso-Pr、cyclo-Pr、CH₂Br、CH₂OMeまたはCH₂OH

〔置換基R²³の具体例〕

H、Me、Et、Pr、CHO、C(O)Me、C(O)Et、C(O)Pr、C(O)CH₂Cl、C(O)CH₂Br、C(O)CF₃、CO₂H、CO₂Me、CO₂Et、CN、CH=NOH、CH=NOMe、C(Me)=NOMe、Cl、Br、NO₂、NH₂、CH₂OH、SMeまたはSO₂Me

本発明化合物は反応式1ないし反応式8に示す方法により製造できる。

〔反応式1〕



[式中、Q-及びXは前記と同様の意味を表し、Hal¹及びHal²は各々独立してハロゲン原子を表し、R⁴⁰はC₁-C₄アルキル基を表す。]

反応式1の工程1はベンゾイル酢酸類(2)とアミジン類またはその塩(3)を塩基存在下、反応させた後、酸処理することにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-1)を製造する工程である。

(3)は(2)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

塩基としては、水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及びテトラメチルグアニジン等があげられる。塩基は(2)に対して通常1~100倍モル、好ましくは1~10倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びトルエン等があげられる。

反応温度は通常-90~200℃、好ましくは0~120℃である。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5~10時間で

ある。

反応終了後、溶媒を留去し、残渣に水を加え、酸処理後、固体をろ取することにより目的物を単離できる。酸処理に使用される酸としては塩酸、硫酸、磷酸及び酢酸があげられる。

工程 2 はピリミジノン誘導体 (1 a - 1) を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1 a - 2) を製造する工程である。

クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルは (1 a - 1) に対して通常 1 ~ 1 0 0 倍モル、好ましくは 1 ~ 1 0 倍モル使用する。

塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウム等があげられる。塩基は (1 a - 1) に対して通常 1 ~ 1 0 0 倍モル、好ましくは 1 ~ 1 0 倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジオキサン及び 1, 2-ジメトキシエタン等があげられる。

反応温度は通常 - 9 0 ~ 2 0 0 ℃、好ましくは 0 ~ 1 2 0 ℃である。

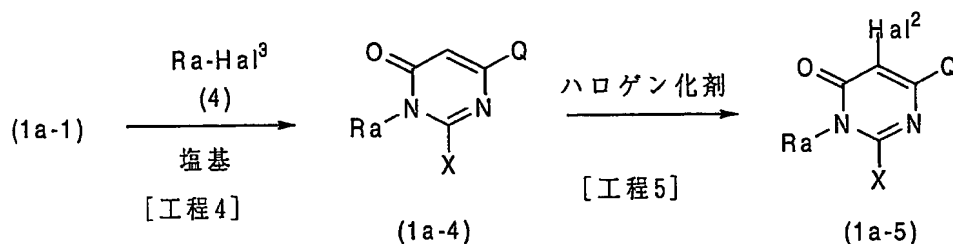
反応時間は通常 0 . 0 5 時間から 1 0 0 時間、好ましくは 0 . 5 ~ 1 0 時間である。

工程 3 はピリミジノン誘導体 (1 a - 2) をハロゲン化剤と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1 a - 3) を製造する工程である。

本反応に使用されるハロゲン化剤としては、塩素、臭素、フッ素、ヨウ素、塩化スルフリル、t e r t - ブチルハイポクロライト、N-クロロコハク酸イミド、N-プロモコハク酸イミド及びN-ヨードコハク酸イミド等があげられる。ハロゲン化剤は (1 a - 2) に対して通常 1 ~ 1 0 0 倍モル、好ましくは 1 ~ 1 0 倍モル使用する。

本反応は必要に応じて触媒を加えることができる。使用される触媒としては塩

〔反応式 2〕



- 27 -

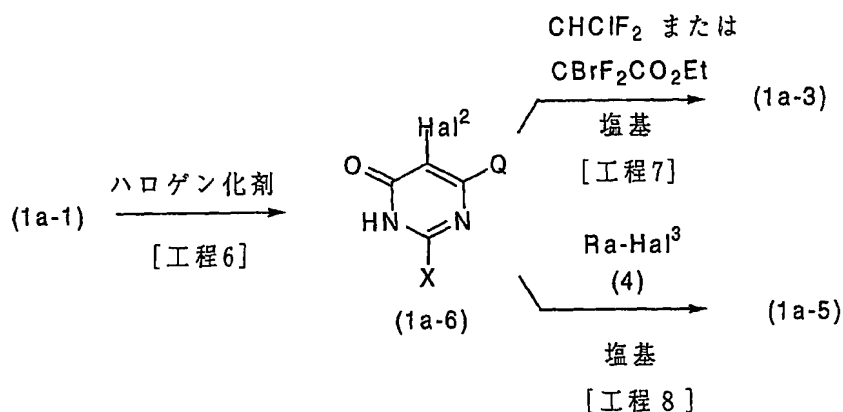
ミド、N、N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジオキサン及び1, 2-ジメトキシエタン等があげられる。

反応温度は通常-90～200℃、好ましくは0～120℃である。

反応時間は通常0.05時間から100時間、好ましくは0.5～10時間である。

工程5はピリミジノン誘導体(1a-4)をハロゲン化剤と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-5)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程3と同様にして実施できる。

〔反応式3〕



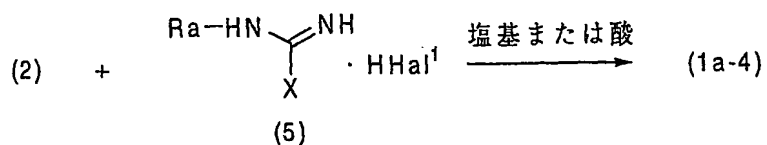
〔式中、Q-、X、Ra、Hal²及びHal³は前記と同様の意味を表す。〕

反応式3の工程6はピリミジノン誘導体(1a-1)をハロゲン化剤と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-6)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程3と同様にして実施できる。

工程7はピリミジノン誘導体(1a-6)を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-3)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程2と同様にして実施できる。

工程8はピリミジノン誘導体(1a-6)を塩基存在下、求電子試薬(4)と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-5)を製造する工程である。本反応は反応式2の工程4と同様にして実施できる。

〔反応式 4〕

〔式中、X、Ra 及び H a l¹ は前記と同様の意味を表す。〕

反応式 4 はベンゾイル酢酸類 (2) とアミジン類またはその塩 (5) を塩基または酸存在下、反応させることにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1 a - 4) を製造する方法を示す。

(5) は (2) に対して通常 1 ～ 1 0 0 倍モル、好ましくは 1 ～ 1 0 倍モル使用する。

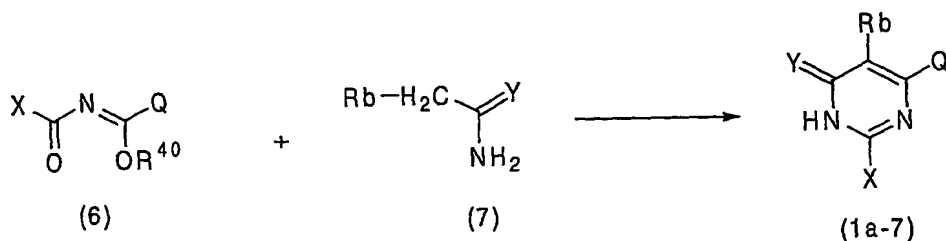
本反応に使用される塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及びテトラメチルグアニジン等があげられ、酸としては、p-トルエンスルホン酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、塩酸、硫酸、燐酸、メタンスルホン酸及びトリフルオロメタンスルホン酸等があげられる。塩基または酸は (2) に対して通常 1 ～ 1 0 0 倍モル、好ましくは 1 ～ 1 0 倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンゼン、トルエン、キシレン、アセトニトリル及びクロロホルム等があげられる。

反応温度は通常 - 9 0 ～ 2 0 0 ℃、好ましくは 0 ～ 1 2 0 ℃である。

反応時間は通常 0 . 0 5 時間から 1 0 0 時間、好ましくは 0 . 5 ～ 1 0 時間である。

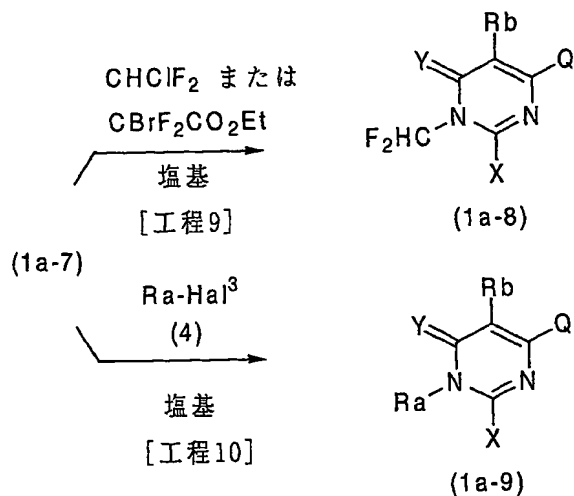
〔反応式 5〕



〔式中、Q、X、Y、Rb及びR⁴⁰は前記と同様の意味を表す。〕

反応式5はアシルイミデート類(6)とアセトアミド類(7)を反応させることにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-7)を製造する方法を示す。本反応は、J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 2447 (1984)に記載されている方法に準じて実施できる。

〔反応式6〕



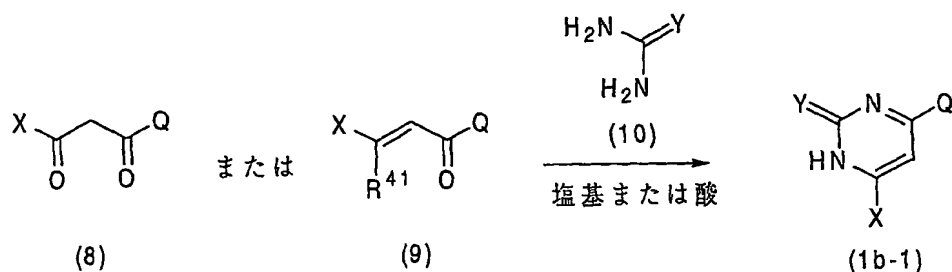
〔式中、Q、X、Y、Ra、Rb及びHal³は前記と同様の意味を表す。〕

反応式6の工程9はピリミジノン誘導体(1a-7)を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはブロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-8)を製造する工程である。本反応は反応式1の工程2と同様にして実施できる。

工程10はピリミジノン誘導体(1a-7)を塩基存在下、求電子試薬(4)と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体(1a-9)を製造する工程である。本反応は反応式2の工程4と同様にして実施できる。

。

〔反応式 7〕



〔式中、Q、X及びYは前記と同様の意味を表し、 R^{41} はN、N-ジメチルアミノ、 C_1 - C_4 アルコキシ基または C_1 - C_4 アルキルチオ基を表す。〕

反応式 7 は β -ジケトン類 (8) またはビニルケトン類 (9) と尿素類 (10) を塩基または酸存在下、反応させることにより、本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1b-1) を製造する方法を示す。

(10) は (8) または (9) に対して通常 1 ~ 100 倍モル、好ましくは 1 ~ 10 倍モル使用する。

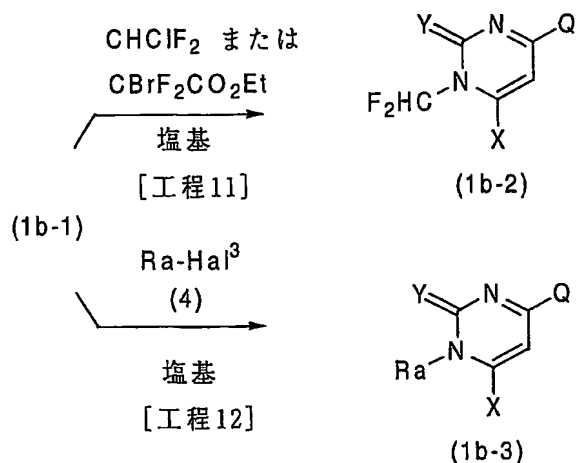
本反応に使用される塩基としては、水素化ナトリウム、水素化リチウム、水素化カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及びテトラメチルグアニジン等があげられ、酸としては、p-トルエンスルホン酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、塩酸、硫酸、磷酸、メタンスルホン酸及びトリフルオロメタンスルホン酸等があげられる。塩基または酸は (8) または (9) に対して通常 1 ~ 100 倍モル、好ましくは 1 ~ 10 倍モル使用する。

本反応は無溶媒でも進行するが、必要に応じて溶媒を使用できる。溶媒は反応に不活性なものであれば特に制限はないが、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンゼン、トルエン、キシレン、アセトニトリル及びクロロホルム等があげられる。

反応温度は通常 -90 ~ 200℃、好ましくは 0 ~ 120℃である。

反応時間は通常 0.05 時間から 100 時間、好ましくは 0.5 ～ 10 時間である。

〔反応式 8〕



〔式中、Q、X、Y、Ra 及び Hal³ は前記と同様の意味を表す。〕

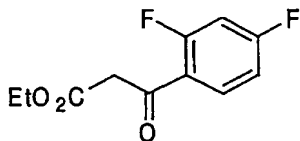
反応式 8 の工程 11 はピリミジノン誘導体 (1b-1) を塩基存在下、クロロジフルオロメタンあるいはプロモジフルオロ酢酸エチルと反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1b-2) を製造する工程である。本反応は反応式 1 の工程 2 と同様にして実施できる。

工程 12 はピリミジノン誘導体 (1b-1) を塩基存在下、求電子試薬 (4) と反応させることにより本発明化合物の一部であるピリミジノン誘導体 (1b-3) を製造する工程である。本反応は反応式 2 の工程 4 と同様にして実施できる。

以下に本発明化合物の合成例を実施例及び参考例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

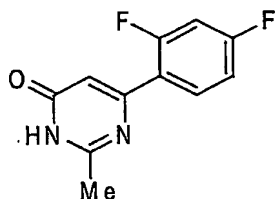
〔実施例 1〕

(1) 2,4-ジフルオロベンゾイル酢酸エチルの合成



マロン酸エチルカリウム（56.5 g）のアセトニトリル（500 ml）懸濁液に、10℃に冷却しながらトリエチルアミン（32 g）と塩化マグネシウム（38.0 g）を加え、室温で5時間攪拌した。氷冷下、2,4-ジフルオロベンゾイルクロライド（28.6 g）をゆっくり滴下した。室温で一晩攪拌後、溶媒留去し、トルエン（200 ml）を加え、氷冷下、6規定塩酸（200 ml）を加えた。有機層を3規定塩酸及び水で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒留去し、目的物21.5 gを得た。油状物質。

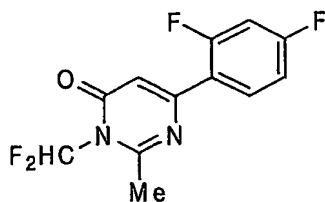
(2) 4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン
(本発明化合物No. 10)の合成



エタノール（250 ml）にアセトアミジン塩酸塩（21.5 g）とナトリウムメトキシド（10.2 g）を加え、15分間加熱還流した。氷冷下、2,4-ジフルオロベンゾイル酢酸エチル（21.5 g）を滴下し、2時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去後、残渣に氷水（200 ml）を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物13.3 gを得た。融点250℃以上。

[実施例2]

1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン（本発明化合物No. 11）の合成



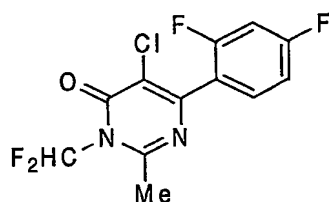
4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン（10.0 g）のN,N-ジメチルホルムアミド（100 ml）溶液に、プロモジフ

ルオロ酢酸エチル (28.0 g)、1, 2-ジメトキシエタン (100 ml) と水素化リチウム (0.90 g) を加え、0.5 時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; ヘキサン/酢酸エチル=9/1) で精製し、目的物 2.60 g を得た。融点 91-92 °C。

また、副生成物として、6-ジフルオロメトキシ-4-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン 2.5 g を得た。融点 60-61 °C。

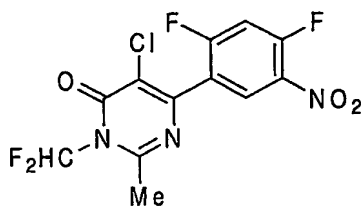
[実施例 3]

(1) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



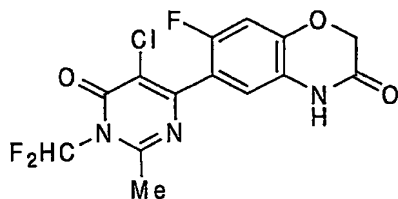
1-ジフルオロメチル-4-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.5 g) のメタノール (25 ml) とクロロホルム (25 ml) 混合溶液に、塩化第二銅 (0.20 g) を加え、10 °C に冷却しながら、tert-ブチルハイポクロライト (2.0 g) をゆっくり滴下した。室温で 1 時間攪拌後、6% 亜硫酸水素ナトリウム水溶液 (50 ml) を加え、0.5 時間激しく攪拌した。クロロホルムで抽出し、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; ヘキサン/酢酸エチル=9/1) で精製し、目的物 2.2 g を得た。油状物質。

(2) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2, 4-ジフルオロ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.0 g) の濃硫酸 (20 ml) 溶液に、氷冷下、硝酸 (60%、 $d = 1.38$ 、1.0 g) をゆっくり滴下し、1時間攪拌した。反応液を氷水 (200 ml) に注ぎ、析出した固体をろ取、水洗、乾燥し、目的物 2.1 g を得た。油状物質。

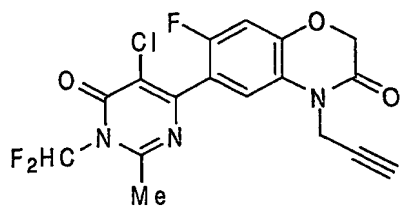
(3) 5-クロロ-4-(7-フルオロ-3-オキソ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,4-ジフルオロ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.0 g) とグリコール酸エチル (1.2 g) のテトラヒドロフラン (50 ml) 溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム (0.35 g) を加えた。室温で3時間攪拌後、水 (300 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣に鉄粉 (2.0 g、酢酸 (10 ml)、酢酸エチル (10 ml) と水 (30 ml) を加え、3時間加熱還流した。水 (50 ml) と酢酸エチル (100 ml) を加え、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、水及び炭酸水素ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をイソプロピルエーテルで再結晶し、目的物 1.1 g を得た。無色固体。

(4) 5-クロロ-4-(7-フルオロ-3-オキソ-4-プロパルギル-2H

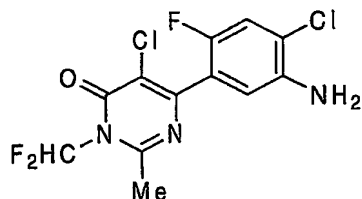
ー１，４－ベンゾオキサジン－６－イル）－１－ジフルオロメチル－２－メチル
ピリミジン－６－オン（本発明化合物 No. 61）の合成



５－クロロ－４－（７－フルオロ－３－オキソ－２Ｈ－１，４－ベンゾオキサ
ジン－６－イル）－１－ジフルオロメチル－２－メチルピリミジン－６－オン（
１．０ｇ）のアセトニトリル（５０ｍｌ）溶液に、プロパルギルブロミド（１．
０ｇ）と炭酸カリウム（０．６ｇ）を加え、３時間加熱還流した。減圧下、溶媒
留去し、残渣に水１００ｍｌを加え、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を
水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、残渣をシリカゲル分取薄層板
（展開溶媒；酢酸エチル／ヘキサン＝３／７）で精製し、目的物０．４５ｇを得
た。融点１９７－１９９℃

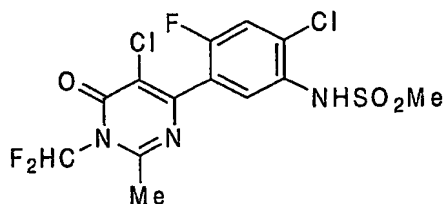
〔実施例４〕

（１）４－（５－アミノ－４－クロロ－２－フルオロフェニル）－５－クロロ－
１－ジフルオロメチル－２－メチルピリミジン－６－オンの合成



５－クロロ－４－（４－クロロ－２－フルオロ－５－ニトロフェニル）－１－
ジフルオロメチル－２－メチルピリミジン－６－オン（３．０ｇ）の酢酸エチル
（１０ｍｌ）溶液に、鉄粉（２．５ｇ）、酢酸（１０ｍｌ）と水（３０ｍｌ）を
加え、３時間加熱還流した。水（５０ｍｌ）と酢酸エチル（１００ｍｌ）を加え
、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、水及び炭酸水素ナトリウム飽和水
溶液で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた固体
をイソプロピルエーテルで再結晶し、目的物２．４ｇを得た。樹脂状物質。

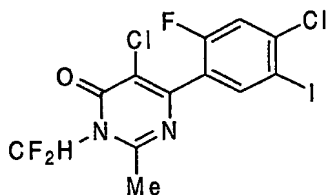
(2) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メタンスルホニルアミノフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 4)の合成



4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(0.70g)の塩化メチレン(3ml)溶液に、氷冷下、メタンスルホニルクロライド0.28gとピリジン0.33gを加えた。室温で3日間攪拌後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を1規定塩酸、水及び炭酸水素ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒留去して得られた残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=1/1)で精製し、目的物0.35gを得た。融点170-172℃。

[実施例5]

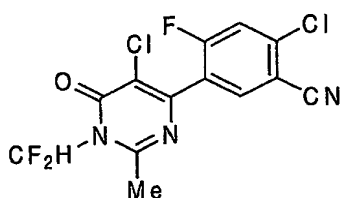
(1) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヨードフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 29)の合成



4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(2.0g)のアセトン(10ml)溶液に12規定塩酸(2ml)、水(15ml)及びヨウ化カリウム(2.0g)を加え、氷冷下、亜硝酸ナトリウム(0.80g)の水(2ml)溶液を滴下した。室温で0.5時間攪拌後、反応混合物を氷水(200ml)及

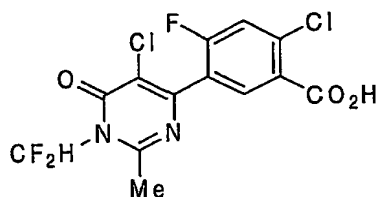
びジエチルエーテル（100 ml）の混合液中に注いだ。激しく攪拌しながら亜硫酸水素ナトリウムをヨウ素の色が消えるまで加えた。エーテル層を分離し、水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液；酢酸エチル／ヘキサン＝1／9）で精製し、目的物 1.9 g を得た。融点 101－102℃。

（2）5-クロロ-4-（4-クロロ-5-シアノ-2-フルオロフェニル）-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン（本発明化合物 No. 30）の合成



5-クロロ-4-（4-クロロ-2-フルオロ-5-ヨードフェニル）-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン（1.6 g）のN,N-ジメチルホルムアミド（20 ml）溶液にシアン化銅（I）（0.42 g）を加え、窒素雰囲気下で5時間加熱還流した。氷冷下、塩化鉄（III）（0.50 g）の濃塩酸（2 ml）溶液を加え、0.25時間激しく攪拌した。反応混合物を水（100 ml）と酢酸エチル（100 ml）の混合溶媒中に注ぎ、不溶物をろ別した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板（展開溶媒；酢酸エチル／ヘキサン＝3／7）で精製し、目的物 1.0 g を得た。融点 124－125℃。

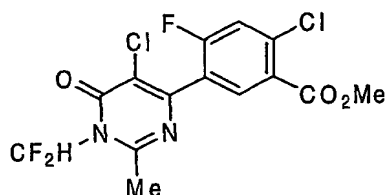
（3）2-クロロ-5-（5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン-4-イル）-4-フルオロ安息香酸の合成



5-クロロ-4-（4-クロロ-5-シアノ-2-フルオロフェニル）-1-

ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (1.0 g) を 49% 硫酸 (10 ml) に加え、0.5 時間加熱還流した。反応混合物を氷水 (200 ml) に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、目的物 0.10 g を得た。無色固体。

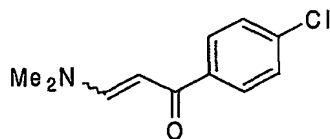
(4) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシカルボニルフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 7) の合成



2-クロロ-5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン-4-イル)-4-フルオロ安息香酸 (0.10 g) に塩化チオニル (2 ml) を加え、2 時間加熱還流した。過剰の塩化チオニルを留去した後、メタノール (5 ml) を加え、3 時間加熱還流した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 0.04 g を得た。油状物質。

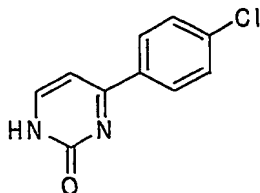
[実施例 6]

(1) 3-(4-クロロフェニル)-1-ジメチルアミノプロペン-3-オンの合成



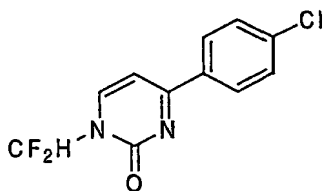
4-クロロアセトフェノン (10 g) に N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール (30 ml) を加え、6 時間加熱還流した。過剰の N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールを留去し、得られた固体をジエチルエーテルで洗浄し、目的物 9.5 g を得た。黄色固体。

(2) 4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-2-オンの合成



3-(4-クロロフェニル)-1-ジメチルアミノプロペン-3-オン (5.0 g) の 1, 2-ジメトキシエタン (50 ml) 溶液に、尿素 (3.6 g) とナトリウムメトキシド (2.6 g) を加え、12 時間加熱還流した。減圧下、溶媒留去し、水 (200 ml) を加え、酸性になるまで 12 規定塩酸を加えた。析出した固体をろ取し、水及びジエチルエーテルで順次洗浄し、目的物 2.0 g を得た。無色固体。

(3) 4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-2-オン (本発明化合物 No. 64) の合成

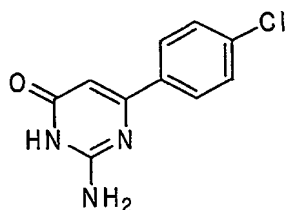


4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-2-オン (2.0 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (20 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (3.0 g)、炭酸カリウム (1.5 g) と炭酸セシウム (0.50 g) を加え、100℃ で 2 時間攪拌した。反応混合物を氷水 (300 ml) に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル/ヘキサン = 2/8) で精製し、目的物 0.60 g を得た。融点 164-166℃。

また、副生物として 0.80 g の 4-(4-クロロフェニル)-2-ジフルオロメトキシピリミジンを得た。融点 112-114℃

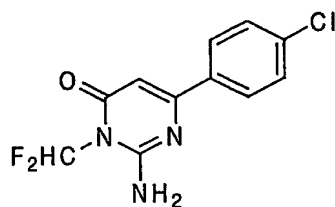
〔実施例 7〕

(1) 2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オンの合成



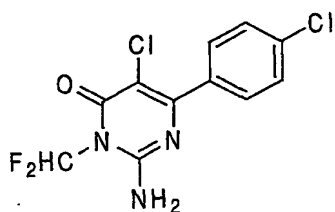
4-クロロベンゾイル酢酸エチル (20.0 g) とグアニジン塩酸塩 (12.6 g) のエタノール (400 ml) 懸濁液に、氷冷下、ナトリウムメトキシド (11.9 g) を加えた後、6時間還流した。溶媒留去後、残渣に氷水 (400 ml) を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 16.0 g を得た。無色固体。

(2) 2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 5) の合成



2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オン (10.0 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (30 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (27.5 g)、1, 2-ジメトキシエタン (30 ml)、水素化リチウム (0.50 g) を加え、ゆっくり加熱した。約80℃にて発泡がはじまった。発泡終了後、0.5時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル/ヘキサン=2/7) で精製し、目的物 3.50 g を得た。融点 136-138℃。

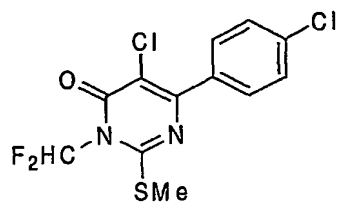
(3) 2-アミノ-5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 6) の合成



2-アミノ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (2.0 g) のクロロホルム (70 ml) 溶液に、氷冷下、tert-ブチルハイポクロライト (1.2 g) を滴下した。室温で2時間攪拌後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8) で精製し、目的物 1.1 g を得た。融点 171-173 °C。

[実施例 8]

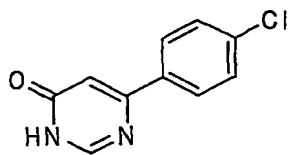
5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルチオピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 23) の合成



ジメチルジスルフィド (30 g) に 2-アミノ-5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (0.80 g) と亜硝酸 tert-ブチル (0.32 g) を加え、80 °C にて 1.5 時間攪拌した。ジメチルジスルフィドを留去して得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8) で精製し、目的物 0.35 g を得た。融点 107-109 °C。

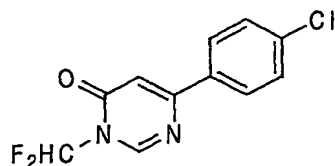
[実施例 9]

(1) 4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オンの合成



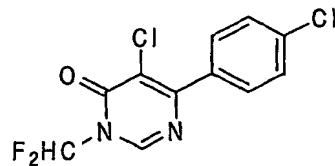
4-クロロベンゾイル酢酸エチル (10 g) とホルムアミジン塩酸塩 (5.4 g) のエタノール (250 ml) 懸濁液に、氷冷下、ナトリウムメトキシド (6.0 g) を加え、8時間還流した。溶媒留去後、残渣に氷水 (250 ml) を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 5.5 g を得た。無色固体。

(2) 4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-クロロフェニル)ピリミジン-6-オン (5.0 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (20 ml) 溶液に、ブromoジフルオロ酢酸エチル (15 g)、1, 2-ジメトキシエタン (20 ml)、水素化リチウム (0.29 g) を加え、ゆっくり加熱した。約80℃にて発泡がはじまった。発泡終了後、1時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8) で精製し、目的物 1.6 g を得た。無色固体。

(3) 5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 18) の合成

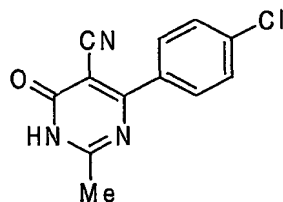


4-(4-クロロフェニル)-1-ジフルオロメチルピリミジン-6-オン (1.5 g) のクロロホルム (70 ml) 溶液に、氷冷下、tert-ブチルハイポクロライト (0.95 g) を加えた。室温で2時間攪拌後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8)

で精製し、目的物 0.80 g を得た。融点 59 – 61 °C。

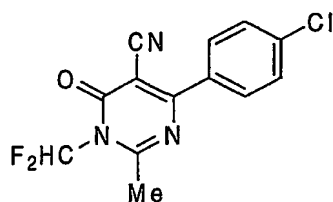
〔実施例 10〕

(1) 4 – (4 – クロロフェニル) – 5 – シアノ – 2 – メチルピリミジン – 6 – オンの合成



メチル N – アセチル – 4 – クロロベンズイミデート (10 g) のメタノール (200 ml) 溶液に、シアノ酢酸アミド (4.0 g) とナトリウムメトキシド (2.6 g) を加え、3 時間還流した。溶媒留去後、残渣に水 (100 ml) とジイソプロピルエーテル (50 ml) を加え抽出し、得られた水層に、酸性になるまで 6 規定塩酸を加えた。析出した固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 2.2 g を得た。無色固体。

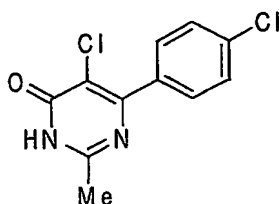
(2) 4 – (4 – クロロフェニル) 5 – シアノ – 1 – ジフルオロメチル – 2 – メチルピリミジン – 6 – オン (本発明化合物 No. 34) の合成



4 – (4 – クロロフェニル) – 5 – シアノ – 2 – メチルピリミジン – 6 – オン (2.0 g) の N, N – ジメチルホルムアミド (10 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (5.0 g)、1, 2 – ジメトキシエタン (20 ml)、水素化リチウム (0.10 g) を加え、ゆっくり加熱した。約 80 °C にて 0.25 時間攪拌した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル / ヘキサン = 2 / 8) で精製し、目的物 0.30 g を得た。融点 154 – 156 °C。

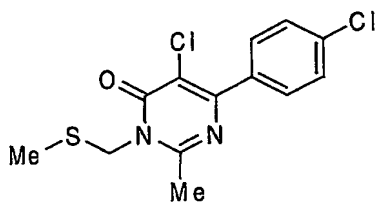
〔実施例 1 1〕

(1) 5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-クロロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (10 g) の酢酸 (100 ml) 溶液に N-クロロコハク酸イミド (6.6 g) を加え、120℃にて、0.5時間攪拌した。減圧下、溶媒留去後、残渣を酢酸エチルに溶解し、水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル) で精製し、目的物 7.0 g を得た。無色固体。

(2) 5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-2-メチル-1-メチルチオメチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 26) の合成

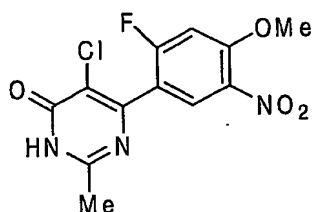


5-クロロ-4-(4-クロロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.50 g) の 1,2-ジメトキシエタン (20 ml) 溶液にクロロメチルメチルスルフィド (0.28 g) を加え、氷冷下、水素化リチウム (0.02 g) を加えた。室温で3時間攪拌後、溶媒留去し、残渣に水を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8) で精製し、目的物 0.22 g を得た。融点 105-107℃。

〔実施例 1 2〕

(1) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)

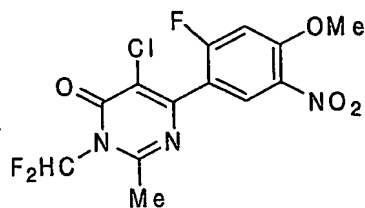
－ 2－メチルピリミジン－ 6－オンの合成



5－クロロ－ 1－ジフルオロメチル－ 4－（ 2， 4－ジフルオロ－ 5－ニトロフェニル）－ 2－メチルピリミジン－ 6－オン（ 0． 5 1 g） のテトラヒドロフラン（ 4 m l） 溶液に、ナトリウムメトキシド（ 0． 2 3 g） を加え、室温で 1 2 時間攪拌した。水（ 3 0 m l） を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液にて順次洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、粗製の目的物 0． 4 2 g を得た。

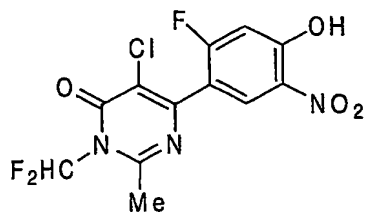
黄色固体。

（ 2 ） 5－クロロ－ 1－ジフルオロメチル－ 4－（ 2－フルオロ－ 4－メトキシ－ 5－ニトロフェニル）－ 2－メチルピリミジン－ 6－オンの合成



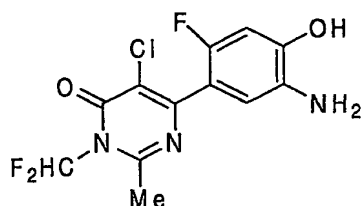
5－クロロ－ 4－（ 2－フルオロ－ 4－メトキシ－ 5－ニトロフェニル）－ 2－メチルピリミジン－ 6－オン（ 0． 4 2 g） の N， N－ジメチルホルムアミド（ 3 m l） 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル（ 1． 1 g）、1， 2－ジメトキシエタン（ 3 m l）、水素化リチウム（ 0． 0 4 g） を加え、1 0 0℃にて 4 分間攪拌した。減圧下、溶媒留去し、残渣に水（ 1 0 m l） を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を 3 規定塩酸、水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 0． 1 6 g を得た。油状物質。

（ 3 ） 5－クロロ－ 1－ジフルオロメチル－ 4－（ 2－フルオロ－ 4－ヒドロキシ－ 5－ニトロフェニル）－ 2－メチルピリミジン－ 6－オンの合成



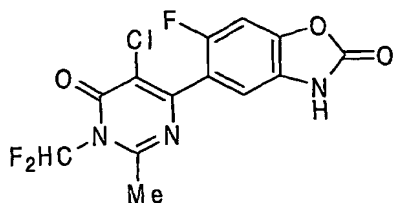
5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.16 g) の塩化メチレン (3 ml) 溶液に、0℃にて三臭化ホウ素 (0.12 ml) を加え、室温で0.75時間攪拌した。氷水 (1 ml) とクロロホルム (20 ml) を加え、室温で攪拌後、不溶物をろ別した。得られたクロロホルム溶液を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をn-ヘキサンで洗浄、乾燥し、目的物0.13 gを得た。黄色固体。

(4) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(5-アミノ-2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



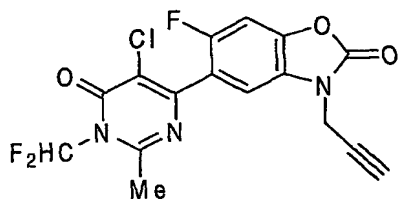
酢酸エチル (2 ml)、酢酸 (1 ml) と水 (2 ml) の混合液に、鉄粉 (0.086 g) を加え、還流しながら、5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.13 g) の酢酸エチル (2 ml) 溶液を滴下した。滴下終了後、さらに0.75時間還流した。不溶物をろ別後、ろ液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をn-ヘキサンで洗浄、乾燥し、目的物0.10 gを得た。樹脂状物質。

(5) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(6-フルオロベンゾオキサゾロン-5-イル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(5-アミノ-2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.10 g) のアセトニトリル (2 ml) 溶液に、N, N'-ジスクシンイミジルカーボネート (0.12 g) を加え、室温で1時間攪拌した。水 (20 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、目的物 0.11 g を得た。無色固体。

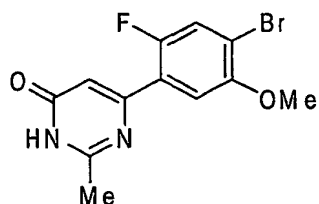
(6) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(6-フルオロ-3-プロパルギルベンゾオキサゾロン-5-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 62) の合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(6-フルオロベンゾオキサゾロン-5-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン (0.11 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、プロパルギルブロミド (0.06 g) と炭酸カリウム (0.09 g) を加え、室温で12時間攪拌した。不溶物をろ別後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/n-ヘキサン = 3/7) で精製し、目的物 0.07 g を得た。融点 160-161℃

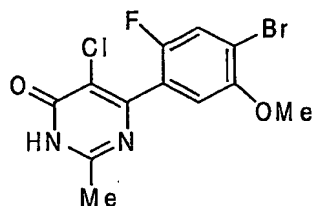
〔実施例 13〕

(1) 4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 50) の合成



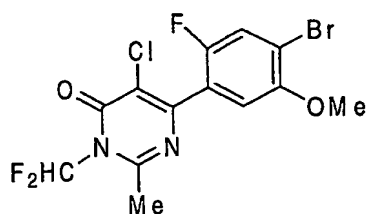
4-ブromo-2-フルオロ-5-メトキシベンゾイル酢酸エチル (20.0 g) のエタノール (400 ml) 溶液に、アセトアミジン塩酸塩 (8.90 g) とナトリウムメトキシド (8.50 g) を加え、6時間還流した。溶媒留去後、残渣に氷水 (200 ml) を加え、酸性になるまで6規定塩酸を加えた。得られた固体をろ取、ジエチルエーテルで洗浄、乾燥することにより、目的物 14.2 g を得た。融点 297-300℃。

(2) 4-(4-ブromo-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



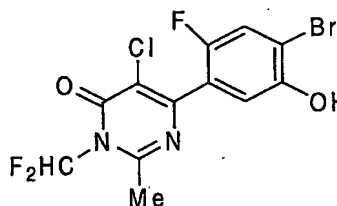
4-(4-ブromo-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (14.0 g) の酢酸 (200 ml) 溶液にN-クロロコハク酸イミド (6.60 g) を加え、120℃にて、0.5時間攪拌した。減圧下、溶媒留去後、残渣を酢酸エチルに溶解し、水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル) で精製し、目的物 14.5 g を得た。無色固体。

(3) 4-(4-ブromo-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 51) の合成



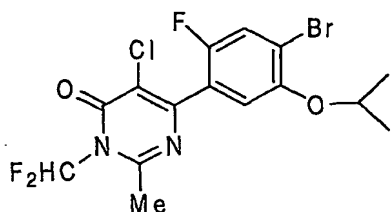
4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オン (15 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (100 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (25 g)、1, 2-ジメトキシエタン (100 ml)、水素化リチウム (0.50 g) を加え、ゆっくり加熱した。80℃付近での発泡がおさまった後、さらに0.5時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水 (200 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル/n-ヘキサン=2/8) で精製し、目的物5.5 gを得た。融点116-117℃。

(4) 4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



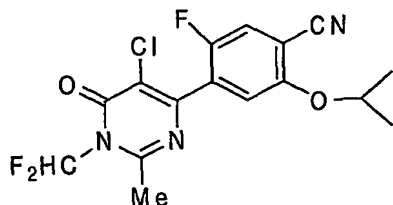
4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (5.0 g) の塩化メチレン (100 ml) 溶液に、0℃にて三臭化ホウ素 (11 g) を加え、室温で18時間撹拌した。反応液を氷水 (200 ml) に加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物3.3 gを得た。無色固体。

(5) 4-(4-ブロモ-2-フルオロ-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-ブromo-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(3.3g)のアセトニトリル(50ml)溶液に、ヨウ化イソプロピル(3.6g)と無水炭酸カリウム(1.8g)を加え、2時間還流した。溶媒留去後、水(100ml)を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、短いアルミナカラムを通過させた後、溶媒留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルで再結晶し、目的物2.8gを得た。無職個体。

(6) 4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 53)の合成

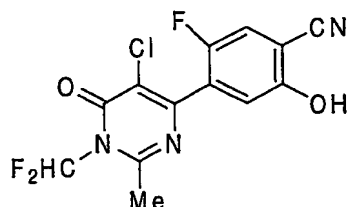


4-(4-ブromo-2-フルオロ-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(2.0g)のN-メチル-2-ピロリドン(25ml)溶液に、シアン化第一銅(0.84g)とヨウ化第一銅(0.20g)を加え、窒素置換した後、155℃にて4時間攪拌した。0℃まで冷却後、6規定塩酸(5ml)を加え、0.25時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル(100ml)と水(100ml)の混合液にあけ、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8)で精製し、目的物0.70gを得た。

樹脂状物質。

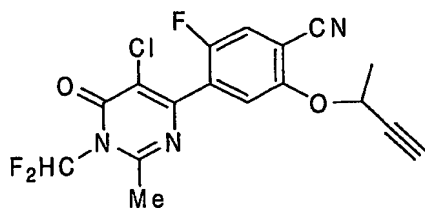
〔実施例 14〕

(1) 5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-イソプロポキシフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (0.70 g) の塩化メチレン (30 ml) 溶液に、0℃にて三臭化ホウ素 (1.4 g) を加え、室温で18時間攪拌した。反応液を氷水 (30 ml) に加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 0.5 g を得た。無色固体。

(2) 5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-(1-メチルプロパルギルオキシ)フェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 52) の合成

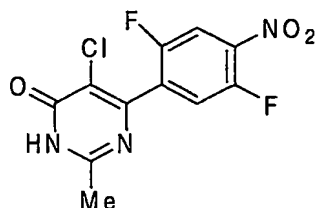


5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (0.40 g) のアセトニトリル (30 ml) 溶液に、1-メチルプロパルギルメチルスルホネート (0.36 g)、無水炭酸カリウム (0.25 g) とヨウ化カリウム (0.06 g) を加え、3時間還流した。溶媒留去後、水 (30 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲル分取薄層板 (展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン = 3/

7) で精製し、目的物 0.35 g を得た。樹脂状物質。

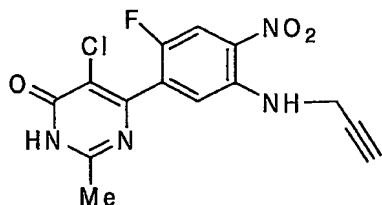
〔実施例 15〕

(1) 5-クロロ-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



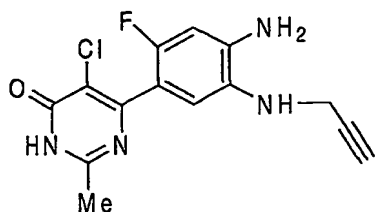
5-クロロ-4-(2,5-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (10 g) の濃硫酸 (40 ml) 溶液に、氷冷下、発煙硝酸 ($d = 1.52$, 8 ml) をゆっくり滴下し、室温で 12 時間攪拌した。反応液を氷水 (300 ml) に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 7.5 g を得た。黄色固体。

(2) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ニトロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



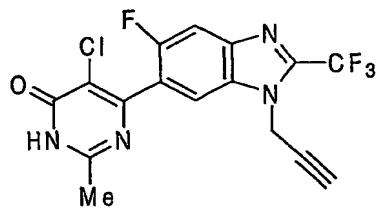
5-クロロ-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (3.0 g) のテトラヒドロフラン (30 ml) 溶液にプロパルギルアミン (1.1 g) とトリエチルアミン (3.0 g) を加え、室温で 12 時間攪拌した。溶媒留去後、水 (50 ml) と濃塩酸 (3 ml) を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去し、粗製の目的物 3.1 g を得た。黄色固体。

(3) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



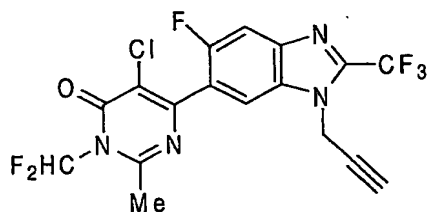
5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ニトロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(1.2 g)の酢酸エチル(15 ml)溶液に酢酸(2 ml)、水(20 ml)と鉄粉(0.80 g)を加え、3時間還流した。不溶物をろ別後、ろ液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去し、粗製の目的物1.2 gを得た。樹脂状物質。

(4) 5-クロロ-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オン(1.0 g)をトリフルオロ酢酸(15 ml)に溶かし、2時間還流した。溶媒留去して得られた残渣に水(20 ml)を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=4/6)で精製し、目的物0.60 gを得た。樹脂状物質。

(5) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 63)の合成

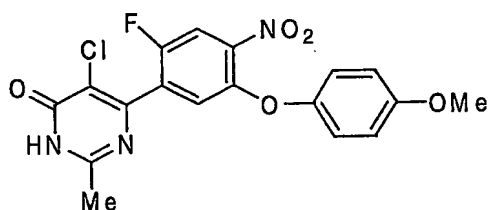


5-クロロ-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン-6-オン(0.60g)のN,N-ジメチルホルムアミド(5ml)溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル(0.95g)、1,2-ジメトキシエタン(5ml)、水素化リチウム(0.02g)を加え、ゆっくり加熱した。80℃付近での発泡がおさまった後、さらに0.25時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水(20ml)を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8)で精製し、目的物0.20gを得た。樹脂状物質。

また、副生成物として、5-クロロ-6-ジフルオロメトキシ-4-(5-フルオロ-1-プロパルギル-2-トリフルオロメチルベンゾイミダゾール-6-イル)-2-メチルピリミジン0.19gを得た。油状物質。

[実施例16]

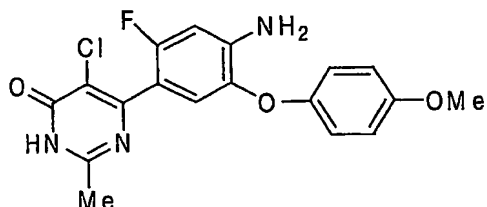
(1) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(5.0g)と4-メトキシフェノール(4.8g)のN,N-ジメチルホルムアミド(50ml)溶液に、0℃にて60%水素化ナトリウム(0.94g)を加え、室温で12時間攪拌した。反応混合物を水(200ml)にあけ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウム

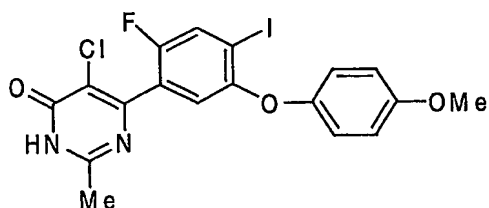
で乾燥後、溶媒留去した。残渣をジエチルエーテルで洗浄、乾燥し、目的物 3. 2 g を得た。黄色固体。

(2) 4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-4-(2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (3. 2 g) の酢酸エチル (30 ml) 溶液に酢酸 (5 ml)、水 (50 ml) と鉄粉 (3. 0 g) を加え、3 時間還流した。不溶物をろ別後、ろ液を酢酸エチルにて抽出した。有機層を水及び塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄後、乾燥し、目的物 2. 5 g を得た。淡黄色固体。

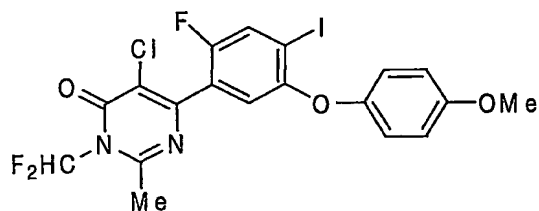
(3) 5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



4-(4-アミノ-2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-5-クロロ-2-メチルピリミジン-6-オン (2. 5 g) のアセトン (20 ml) 溶液に 12 規定塩酸 (8 ml)、水 (10 ml) 及びヨウ化カリウム (2. 0 g) を加え、氷冷下、亜硝酸ナトリウム (1. 1 g) の水 (4 ml) 溶液を滴下した。室温で 0. 5 時間攪拌後、反応混合物を氷水 (50 ml) 及びジエチルエーテル (50 ml) の混合液中に注いだ。激しく攪拌しながら亜硫酸水素ナトリウムをヨウ素の色が消えるまで加えた。エーテル層を分離し、水洗、無水

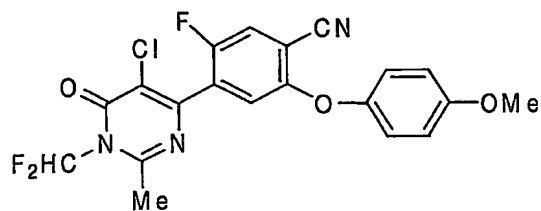
硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄、乾燥して目的物 2.1 g を得た。無色固体。

(4) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (2.1 g) の N, N-ジメチルホルムアミド (10 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (2.9 g)、1,2-ジメトキシエタン (10 ml)、水素化リチウム (0.06 g) を加え、ゆっくり加熱した。80℃付近での発泡がおさまった後、さらに 0.25 時間還流した。減圧下、溶媒留去し、残渣に氷水 (50 ml) を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; 酢酸エチル/ヘキサン = 1/9) で精製し、目的物 1.7 g を得た。淡黄色固体。

(5) 5-クロロ-4-(4-シアノ-2-フルオロ-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 60) の合成

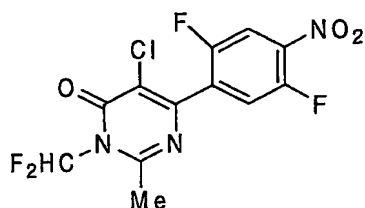


5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ヨード-5-(4-メトキシフェノキシ)フェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (1.6 g) の N-メチル-2-ピロリドン (20 ml) 溶液に、シアン化第一銅 (

0.52 g)を加え、窒素置換した後、150℃にて3時間撹拌した。0℃まで冷却後、12規定塩酸(3 ml)を加え、0.25時間撹拌した。反応混合物を酢酸エチル(50 ml)と水(50 ml)の混合液にあげ、不溶物をろ別した。ろ液の有機層を分離し、塩化ナトリウム飽和水溶液で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をシリカゲル分取薄層板(展開溶媒; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8)で精製し、目的物0.35 gを得た。融点146-148℃。

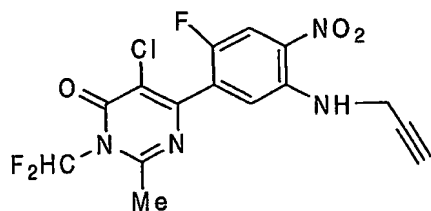
〔実施例17〕

(1) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,5-ジフルオロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(3.0 g)の濃硫酸(20 ml)溶液に、氷冷下、発煙硝酸(d=1.52、2 ml)をゆっくり滴下し、室温で12時間撹拌した。反応液を氷水(100 ml)に注ぎ、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液; 酢酸エチル/ヘキサン=2/8)で精製し、目的物2.2 gを得た。淡黄色固体。

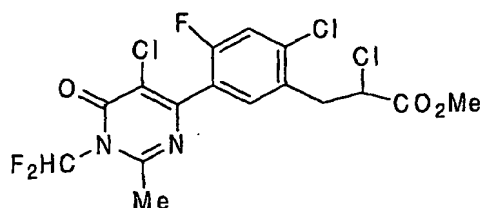
(2) 5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2-フルオロ-4-ニトロ-5-プロパルギルアミノフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(本発明化合物No. 54)の合成



5-クロロ-1-ジフルオロメチル-4-(2,5-ジフルオロ-4-ニトロフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン(2.0g)のテトラヒドロフラン(30ml)溶液にプロパルギルアミン(0.63g)とトリエチルアミン(1.2g)を加え、室温で12時間攪拌した。溶媒留去後、水(50ml)を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をジエチルエーテルに溶解し、短いシリカゲルカラムを通し、溶媒留去し、目的物1.6gを得た。樹脂状物質。

〔実施例18〕

3-(5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチル-6-オキソヒドロピリミジン-4-イル)-2-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-クロロプロピオン酸メチル(本発明化合物No.65)の合成

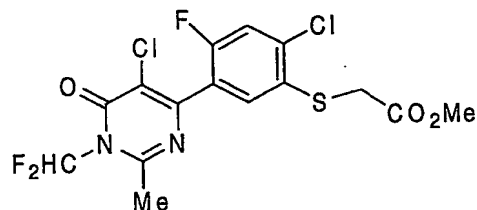


アクリル酸メチル(1.1g)のアセトニトリル(20ml)溶液に亜硝酸ターシャリーブチル(0.96g)と塩化第二銅(0.91g)を加え、0℃にて、4-(5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン(2.1g)のアセトニトリル(10ml)溶液を滴下した。室温で40分間攪拌後、溶媒留去した。得られた残渣に3規定塩酸(50ml)を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を3規定塩酸、水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液;酢酸エチル/ヘキサン=1/5)で精製し、目的物0.64gを得た。油状物質。

〔実施例19〕

3-(5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチル-6-オキソヒドロピリミジン-4-イル)-2-クロロ-4-フルオロフェニルチオ)酢酸メ

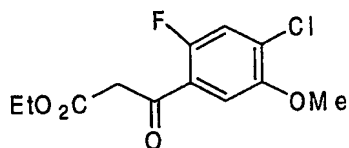
チル（本発明化合物 No. 70）の合成



4-（5-アミノ-4-クロロ-2-フルオロフェニル）-5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチルピリミジン-6-オン（1.2 g）に35%塩酸（1.0 ml）を加え、50℃にて0.5時間攪拌した。室温まで冷却後、アセトン（10 ml）、水（8 ml）とチオグリコール酸メチル（0.91 ml）を加え、0℃にて、亜硝酸ナトリウム（0.70 g）の水（2 ml）溶液を滴下した。室温で3時間攪拌後、水（50 ml）を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液；酢酸エチル／ヘキサン＝1／5）で精製し、目的物0.16 gを得た。融点126-128℃。

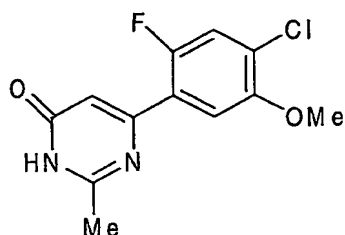
〔実施例20〕

（1）（4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシベンゾイル）酢酸エチルの合成



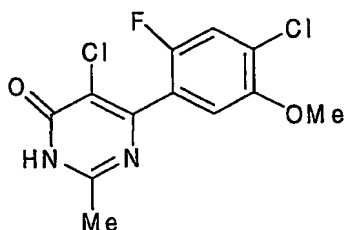
原料に4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシベンゾイルクロリド（21.9 g）を使用し、実施例1の（1）と同様にして目的物18.5 gを得た。融点63-64℃。

（2）4-（4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル）-2-メチルピリミジン-6-オンの合成



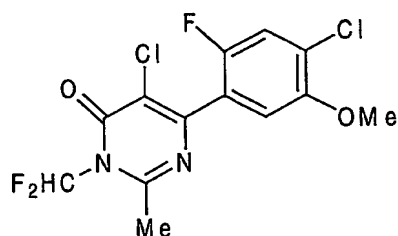
原料に（４－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシベンゾイル）酢酸エチル（１３．８ｇ）を使用し、実施例１の（２）と同様にして目的物９．３８ｇを得た。無色固体。

（３）５－クロロ－４－（４－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシフェニル）－２－メチルピリミジン－６－オンの合成



４－（４－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシフェニル）－２－メチルピリミジン－６－オン（５．００ｇ）の酢酸（１７０ｍｌ）溶液にＮ－クロロコハク酸イミド（２．７０ｇ）を加え、１２０℃にて、１時間撹拌した。反応液を室温まで冷却後、水（３００ｍｌ）にあげ、クロロホルムで抽出した。有機層を水、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液、塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥、溶媒留去して目的物５．３２ｇを得た。融点２５８－２６４℃。

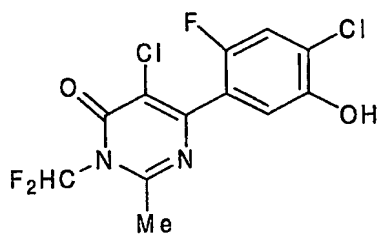
（４）５－クロロ－４－（４－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシフェニル）－１－ジフルオロメトキシ－２－メチルピリミジン－６－オン（本発明化合物Ｎｏ．４０）の合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-メチルピリミジン-6-オン (5.32 g) のN, N-ジメチルホルムアミド (50 ml) 溶液に、プロモジフルオロ酢酸エチル (35.6 g)、1, 2-ジメトキシエタン (50 ml) と水素化リチウム (1.39 g) を加え、攪拌しながら 100℃ にて 5 分間加熱した。室温まで冷却後、水 (500 ml) にあけ、ジエチルエーテルで抽出した。有機層を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥、溶媒留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; ヘキサン/酢酸エチル = 4/1) で精製し、目的物 1.25 g を得た。融点 130-131℃。

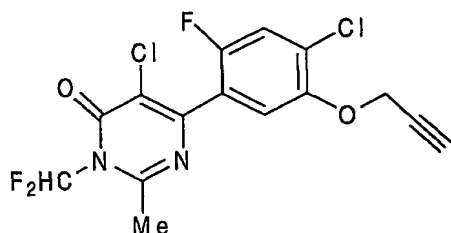
〔実施例 21〕

(1) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 73) の合成



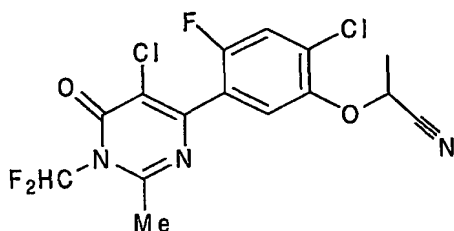
5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-メトキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (0.30 g) の塩化メチレン (10 ml) 溶液に、0℃ にて三臭化ホウ素 (0.51 g) を加えた。室温にて 1.5 時間攪拌後、水 (20 ml) を加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒留去し、目的物 0.30 g を得た。油状物質。

(2) 5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-プロパルギルオキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (本発明化合物 No. 41) の合成



5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (0.13 g) のアセトニトリル (10 ml) 溶液に無水炭酸カリウム (0.065 g) とプロパルギルプロミド (0.052 g) を加え、1時間還流した。室温まで冷却後、水 (20 ml) を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。有機層を水および塩化ナトリウム飽和水溶液で順次洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、溶媒留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液; ヘキサン/酢酸エチル = 3/1) で精製して目的物 0.84 g を得た。融点 124-125℃。

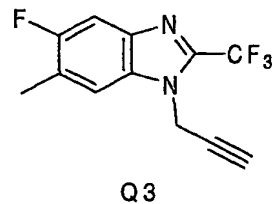
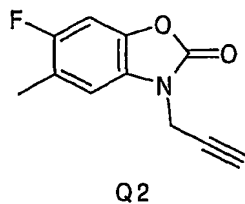
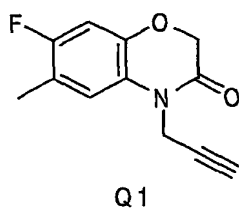
(3) 2-(5-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-2-メチル-6-オキソヒドロピリミジン-4-イル)-2-クロロ-4-フルオロフェノキシ)プロパンニトリル (本発明化合物 No. 94) の合成



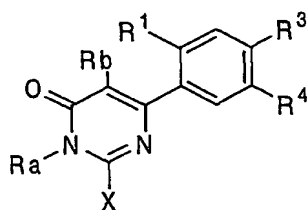
5-クロロ-4-(4-クロロ-2-フルオロ-5-ヒドロキシフェニル)-1-ジフルオロメトキシ-2-メチルピリミジン-6-オン (0.20 g) のテトラヒドロフラン (2.5 ml) 溶液にトリフェニルホスフィン (0.39 g)、ラクトニトリル (0.11 g) とアゾジカルボン酸ジエチル (0.26 g) を加えた。室温で18時間攪拌後、溶媒留去し、得られた残渣をシリカゲル分取薄

層板（展開溶媒；酢酸エチル／ヘキサン＝１／２）で精製し、目的物 0.16 g を得た。融点 133－134℃。

前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式と物性を前記実施例を含め第 1 表ないし第 3 表に示す。但し表中の記号は前記と同様の意味を表し、Q 1、Q 2 及び Q 3 は以下の意味を表す。



〔第 1 表〕



No.	Ra	Rb	X	R ¹	R ³	R ⁴	物性値（融点、℃）
1	CHF ₂	H	Me	H	Cl	H	126-128
2	CHF ₂	Cl	Me	H	Cl	H	97-99
3	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	H	樹脂状物質
4	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	NHSO ₂ Me	170-172
5	CHF ₂	H	NH ₂	H	Cl	H	136-138
6	CHF ₂	Cl	NH ₂	H	Cl	H	171-173
7	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CO ₂ Me	油状物質
8	H	H	Me	F	Cl	H	>280（分解）
9	CHF ₂	H	Me	F	Cl	H	95-96
10	H	H	Me	F	F	H	>250（分解）
11	CHF ₂	H	Me	F	F	H	91-92

12	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	NHCH ₂ C≡CH	150-152
13	Me	H	Me	H	Cl	H	152-154
14	Me	Cl	Me	H	Cl	H	215-217
15	iso-Pr	Cl	Me	H	Cl	H	91-93
16	MeOCH ₂	Cl	Me	H	Cl	H	104-106
17	MeOCH ₂	H	Me	H	Cl	H	92-94
18	CHF ₂	Cl	H	H	Cl	H	59-61
19	CHF ₂	Cl	Me	H	Cl	H	85-87
20	H	Cl	Me	H	Cl	H	294-296
21	H	H	Me	F	Br	H	> 270 (分解)
22	CHF ₂	H	Me	F	Br	H	107-108
23	CHF ₂	Cl	MeS	H	Cl	H	107-109
24	CHF ₂	Cl	Me	F	Br	H	油状物質
25	CH≡CCH ₂	Cl	Me	H	Cl	H	133-135
26	MeSCH ₂	Cl	Me	H	Cl	H	105-107
27	MeSO ₂ CH ₂	Cl	Me	H	Cl	H	224-226
28	MeOCO	Cl	Me	H	Cl	H	125-127
29	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	I	101-102
30	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CN	124-125
31	CHF ₂	Cl	Me	F	Br	NH ₂	54-55
32	CHF ₂	Cl	Me	F	Br	NHSO ₂ Et	149-151
33	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	N(C(=O)(tert-Bu))SO ₂ Et	64-65
34	CHF ₂	CN	Me	H	Cl	H	154-156
35	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	NHSO ₂ Et	169-170
36	CF ₂ CH ₂	Cl	Me	H	Cl	H	123-125
37	CH ₂ F(CH ₂) ₂	Cl	Me	H	Cl	H	114-116
38	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	N(SO ₂ CH ₂ Cl) ₂	187-188
39	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	NHSO ₂ CH ₂ Cl	172-173
40	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OMe	130-131

41	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C≡CH	124-125
42	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ OMe	121-122
43	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CO ₂ Me	98-99
44	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O)Me	128-129
45	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CMe(=NOMe)	104-106
46	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CO ₂ Et	93-94
47	CHF ₂	Cl	Me	F	NO ₂	OCH ₂ C≡CH	油状物質
48	CHF ₂	CH≡CCH ₂ O	Me	F	NO ₂	F	油状物質
49	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CO ₂ (iso-Pr)	油状物質
50	H	H	Me	F	Br	OMe	297-300
51	CHF ₂	Cl	Me	F	Br	OMe	116-117
52	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	OCHMeC≡CH	樹脂状物質
53	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	O(iso-Pr)	樹脂状物質
54	CHF ₂	Cl	Me	F	NO ₂	NHCH ₂ C≡CH	樹脂状物質
55	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	OCH ₂ C≡CH	樹脂状物質
56	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	OCH ₂ OMe	樹脂状物質
57	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	O(cyclo-Pen)	樹脂状物質
58	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	OCH ₂ CO ₂ Et	127-129
59	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	OCMe ₂ C≡CH	133-135
60	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	O(4-MeO-Ph)	146-148
65	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ Me	油状物質
66	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCOMe	油状物質
67	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ Et	油状物質
68	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClSO ₂ Ph	63-65
69	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMe ₂	57-59
70	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	SCH ₂ CO ₂ Me	126-128
71*	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH=CClCO ₂ Et	油状物質
72	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCN	76-78
73	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OH	油状物質

74	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CMeClCO ₂ Me	油状物質
75	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHBrCO ₂ Me	34-36
76	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCH ₂ Cl	油状物質
77	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClOC(O)Me	35-37
78	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂	108-109
79	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OPr	91-92
80	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ Ph	油状物質
81	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	油状物質
82	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ H	138-140
83	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CH ₂ CO ₂ Me	油状物質
84	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ (iso-Pr)	油状物質
85	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	油状物質
86	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH=CHMe	90-91
87	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)CH=CMe ₂	127-129
88	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)Me	105-107
89	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)CH ₂ Cl	油状物質
90	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)CH ₂ OMe	油状物質
91	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ OCH=CH ₂	101-102
92	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ C≡CH	100-102
93	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CN	油状物質
94	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCN	油状物質
95	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	O(2,3-エポキシプロピル)	144-146
96	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OEt	113-115
97	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (cyclo-Pen)	油状物質
98	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (cyclo-Bu)	油状物質
99	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (テトラヒドロフラン-3-イル)	油状物質
100	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH(CH ₂ F) ₂	99-101
101	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (3-メチルオキサタン-3-イル)	油状物質
102	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (cyclo-Pr)	油状物質

103	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ F	132-133
104	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CHF ₂	油状物質
105	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	O(sec-Bu)	油状物質
106	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMe(cyclo-Pr)	油状物質
107	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ Bu	油状物質
108	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ (iso-Bu)	油状物質
109	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ (tert-Bu)	油状物質
110	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ (cyclo-Hex)	油状物質
111	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	油状物質
112	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CF ₃	油状物質
113	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH(CF ₃) ₂	油状物質
114	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH ₂	164-166
115	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CMeClC(O)NMe ₂	油状物質
116	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)(モルホリン-1-イル)	64-66
117	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ (テトラヒト*ロフラン-2-イル)	油状物質
118	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ OC(O)Me	油状物質
119	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ (モルホリン-1-イル)	油状物質
120	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCH=CH ₂	油状物質
121	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	O(cyclo-Pen)	油状物質
122	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OSO ₂ Me	185-187
123	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (2,2-シ*メチル-1,3-シ*オキサラン-4-イル)	油状物質
124	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCH ₂ OMe	油状物質
125	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCH ₂ C≡CH	油状物質
126	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ (ピ*ロリシ*ン-1-イル)	油状物質
127	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ OPr	114-115
128	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (テトラヒト*ロフラン-2-イル)	油状物質
129	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClP(O)(OEt) ₂	油状物質
130	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ Pr	油状物質
131	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ (2-クロロフ*タリト*-2-イル)	油状物質

132	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CCl ₂ CN	油状物質
133	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClSO ₂ Me	油状物質
134	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHBrC(O)NMe ₂	油状物質
135	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHMe	54-56
136	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCH ₂ CH=CH ₂	油状物質
137	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (テトラヒドロフラン-3-イル)	油状物質
138	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)NMe ₂	150-152
139	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCO ₂ Me	油状物質
140**	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCO ₂ Me	油状物質
141***	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHMeCO ₂ Me	油状物質
142	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ (2-ヒドロキシ-1-イル)	油状物質
143	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	85-87
144	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	O(4-フタリル-2-イル)	油状物質
145	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHOMe	68-71
146	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CH ₂ C(O)NMe ₂	油状物質
147	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)Et	107-108
148	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OC(O)CH ₂ CCl ₃	145-146
149	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHEt	148-150
150	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(iso-Pr)	157-159
151	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(iso-Bu)	93-95
152	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(sec-Bu)	105-107
153	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(tert-Bu)	65-67
154	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(cyclo-Pr)	179-181
155	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(cyclo-Hex)	92-95
156	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHCH ₂ C≡CH	52-54
157	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHCH ₂ CH ₂ OMe	45-47
158	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHCH ₂ CH ₂ NMe ₂	148-152
159	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHCH ₂ CO ₂ Et	63-65
160	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHCH(iso-Pr)CO ₂ Me	47-50

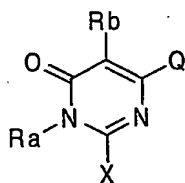
161	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHNMe ₂	168-171
162	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(モルホリン-1-イル)	107-109
163	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHPH	53-55
164	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(チアゾール-2-イル)	58-60
165	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NH(5-メチルイソキサゾール-3-イル)	78-81
166	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NHCH ₂ Ph	108-110
167	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMeBu	43-45
168	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMe(iso-Bu)	48-51
169	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMeOMe	油状物質
170	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NEt ₂	41-43
171	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NEtPr	油状物質
172	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NEt(iso-Pr)	35-37
173	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NEtBu	油状物質
174	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NEt(tert-Bu)	油状物質
175	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(iso-Pr) ₂	37-39
176	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NPr(sec-Bu)	油状物質
177	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	油状物質
178	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(iso-Pr)(cyclo-Hex)	油状物質
179	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(CH ₂ CH=CH ₂)(cyclo-Hex)	油状物質
180	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(CH ₂ CH=CH ₂)(cyclo-Pen)	油状物質
181	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMePh	油状物質
182	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMe(ピロリジン-2-イル)	70-72
183	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(ピロリジン-1-イル)	60-62
184	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(=NOMe)OCH ₂ CO ₂ Me	油状物質
185	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ (sec-Bu)	油状物質
186	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	油状物質
187	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CHMeCH=CH ₂	油状物質
188	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ C≡CH	油状物質
189	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CHMeC≡CH	油状物質

190	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ (cyclo-Pr)	油状物質
191	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CHClCH ₂ Cl	油状物質
192	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CH=CMeCl	油状物質
193	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	油状物質
194	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CONH ₂	166-170
195	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCO(モルホリン-1-イル)	油状物質
196	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CCl=CH ₂	86-88
197	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHEtC≡CH	油状物質
198	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHPrC≡CH	油状物質
199	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH(iso-Bu)C≡CH	油状物質
200	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMeCH ₂ CO ₂ Et	32-34
201	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(cyclo-Hex)Ph	58-60
202	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(4-メチルピペラジーン-1-イル)	164-167
203	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(チオモルホリン-1-イル)	50-53
204	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OSO ₂ CF ₃	93-94
205	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (1,5-シメチルピラゾール-1-イル)	199-201
206	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHFCO ₂ Et	油状物質
207	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ Br	油状物質
208	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CH ₂ CN	114-116
209	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CF ₃	88-90
210	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCF ₂ CO ₂ Et	油状物質
211	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClCO ₂ CH ₂ CO ₂ Et	油状物質
212	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)N(CH ₂ CH ₂ Cl) ₂	油状物質
213	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ (4-MeOCH ₂ O-Ph)	油状物質
214	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(=NOMe)OMe	油状物質
215	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHMeCO ₂ Me	油状物質
216	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C≡CCH ₂ Cl	146-148
217	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	O(1-メチルピペラジーン-3-イル)	151-153
218	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O)NEt ₂	134-136

219	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O) (ヒ°ロリシ°ン-1-イル)	157-159
220	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O) (モルホリン-1-イル)	185-187
221	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O)NMe(CH ₂ C≡CH)	油状物質
222	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	113-115
223	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ CO ₂ CH ₂ CF ₃	126-128
224	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHCl(=NOMe)OC(O)Me	43-45
225	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O)NHMe	166-168
226	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ C(O)NMe ₂	122-125
227	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH(CH ₂ Cl)CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	油状物質
228	CHF ₂	Cl	Me	F	CN	CH ₂ CHClCO ₂ Me	油状物質
229	CHF ₂	Cl	Me	F	Br	CH ₂ CHClCO ₂ Me	油状物質
230	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(O)NMe(iso-Pr)	45-47
231	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	Me	油状物質
232	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ CHClC(=NOMe)OCH ₂ OMe	油状物質
233	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH(iso-Bu)C≡CH	油状物質
234	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ SiMe ₃	油状物質
235	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	CH ₂ OMe	84-86
236	CHF ₂	Cl	Me	F	Cl	OCHBuC≡CH	油状物質

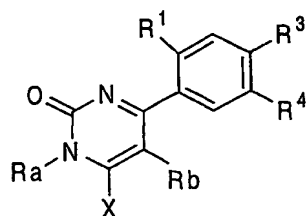
*) E体とZ体の混合物。**) S体。***) R体。

〔第2表〕



No.	Ra	Rb	X	Q-	物性値 (融点、℃)
61	CHF ₂	Cl	Me	Q1	197-199
62	CHF ₂	Cl	Me	Q2	160-161
63	CHF ₂	Cl	Me	Q3	樹脂状物質

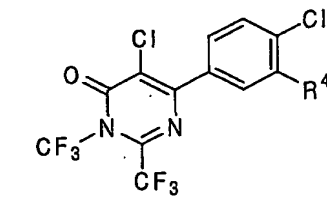
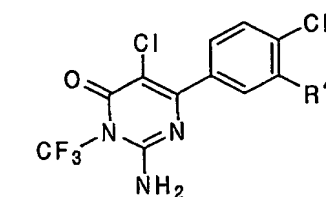
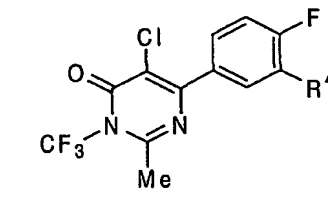
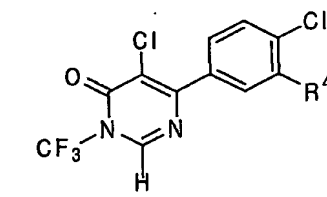
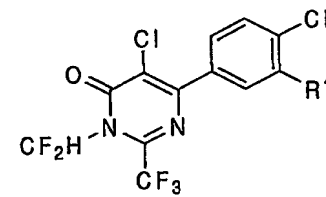
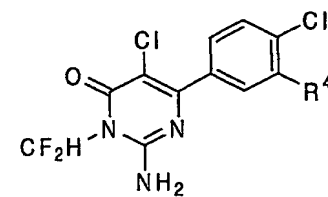
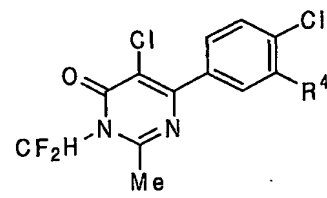
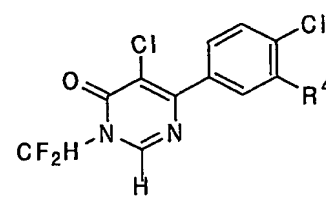
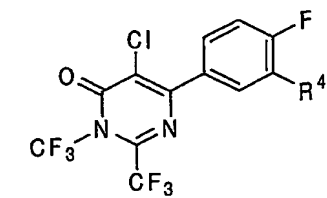
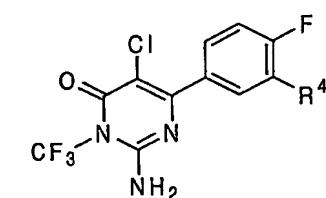
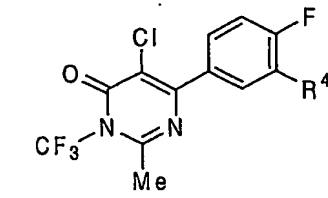
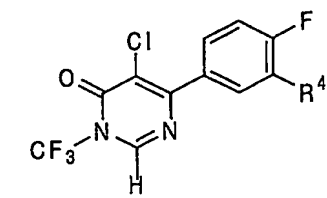
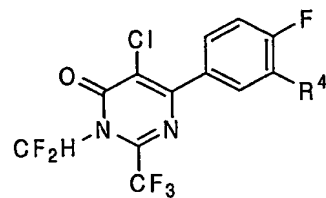
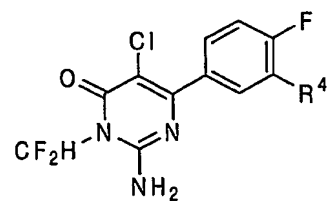
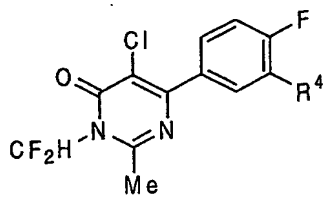
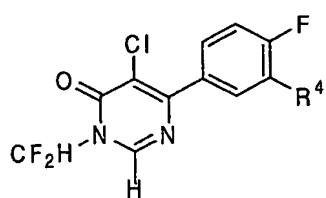
〔第 3 表〕

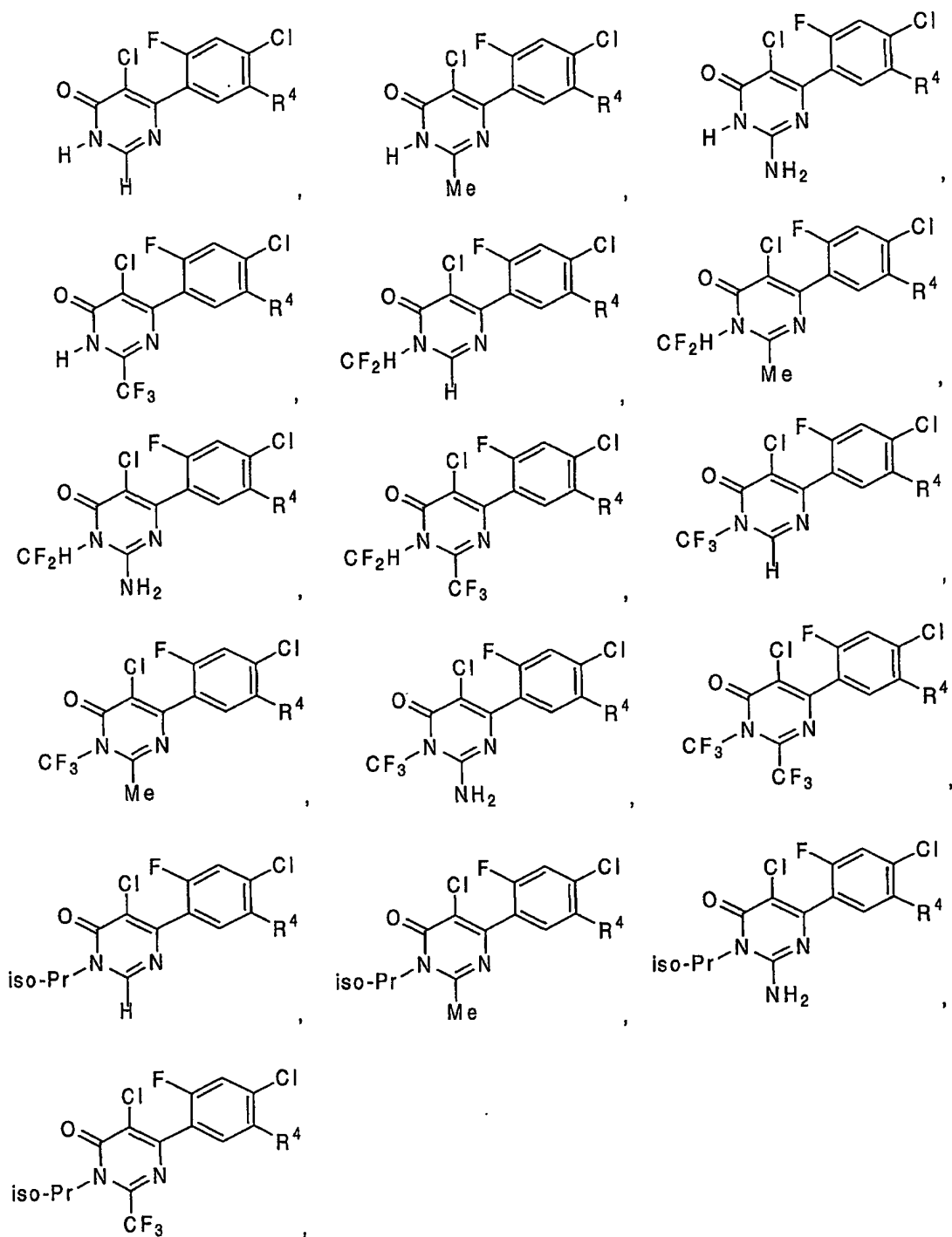


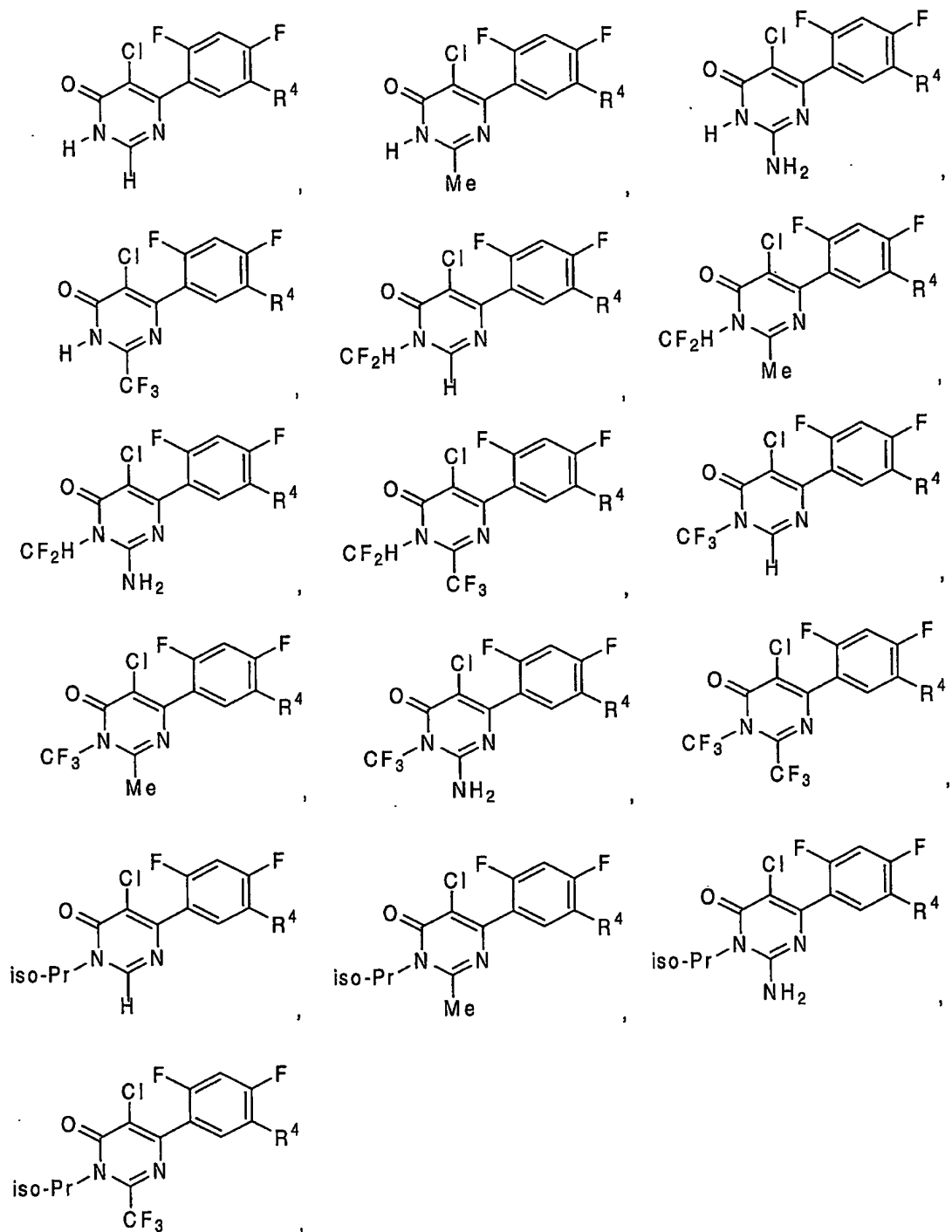
No.	Ra	Rb	X	R ¹	R ³	R ⁴	物性値（融点、℃）
64.	CHF ₂	H	H	H	Cl	H	164-166

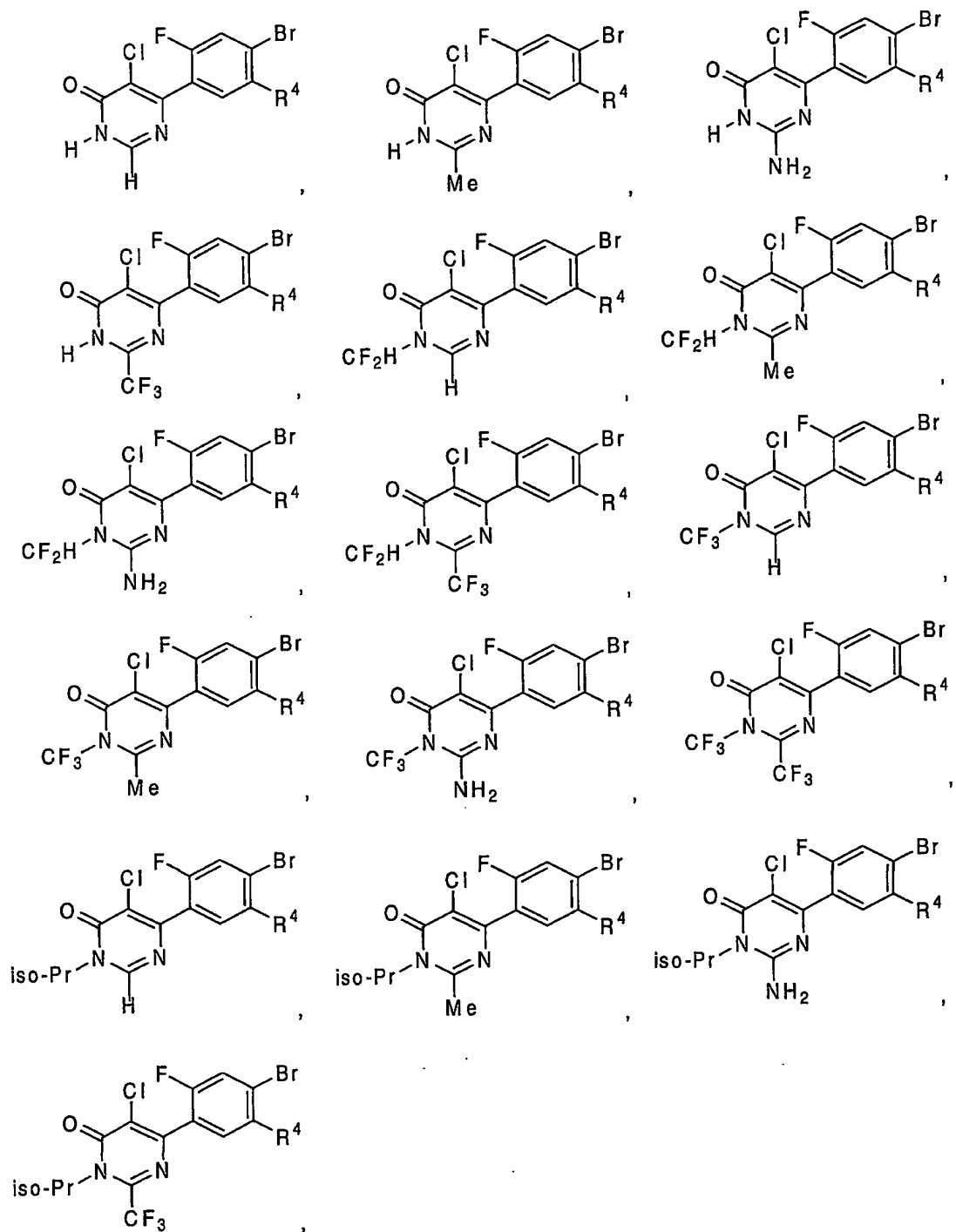
次に、本発明に含まれる化合物の例を、前記実施例で合成した化合物を含め、第 4 表～第 6 表に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

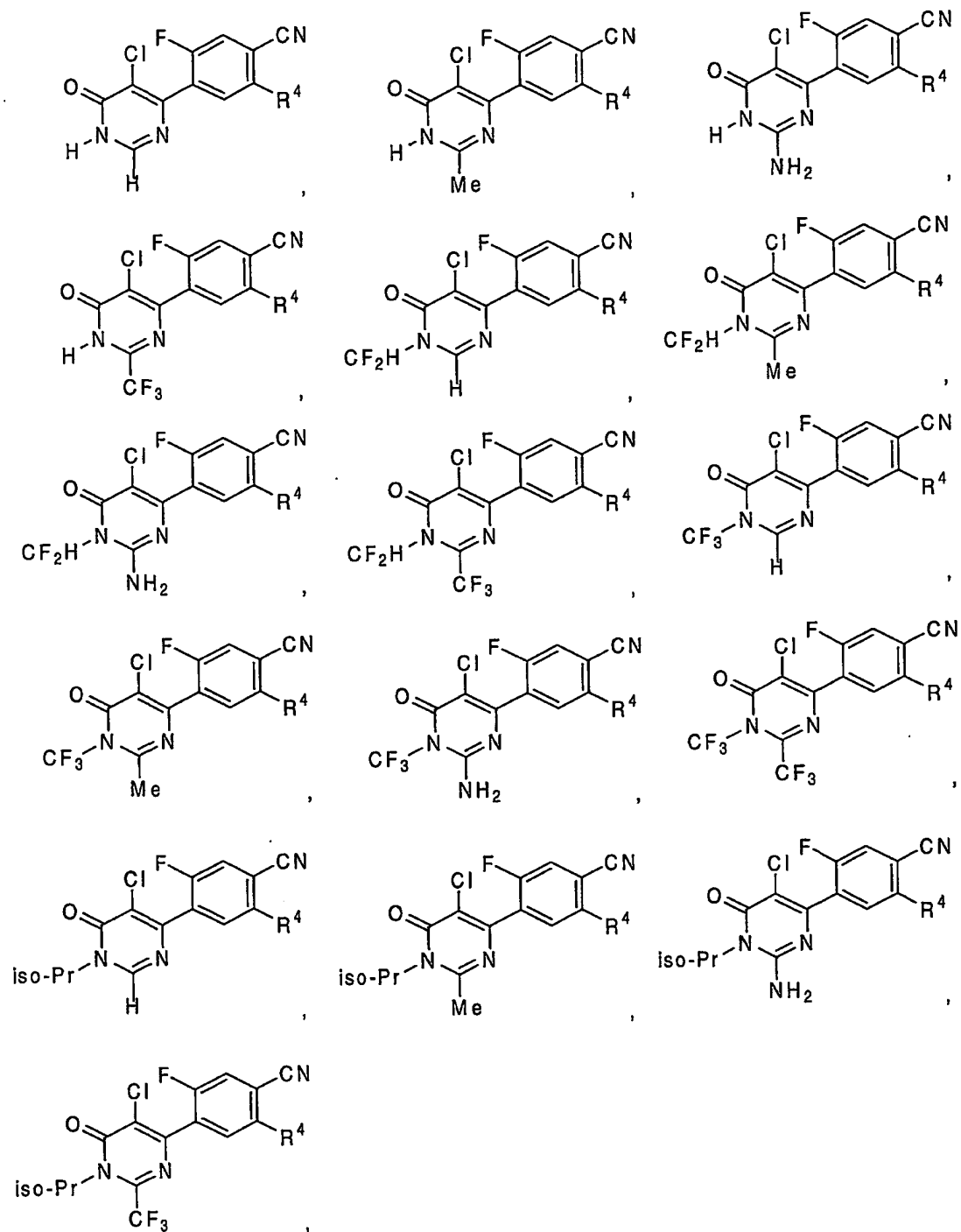
〔第 4 表〕

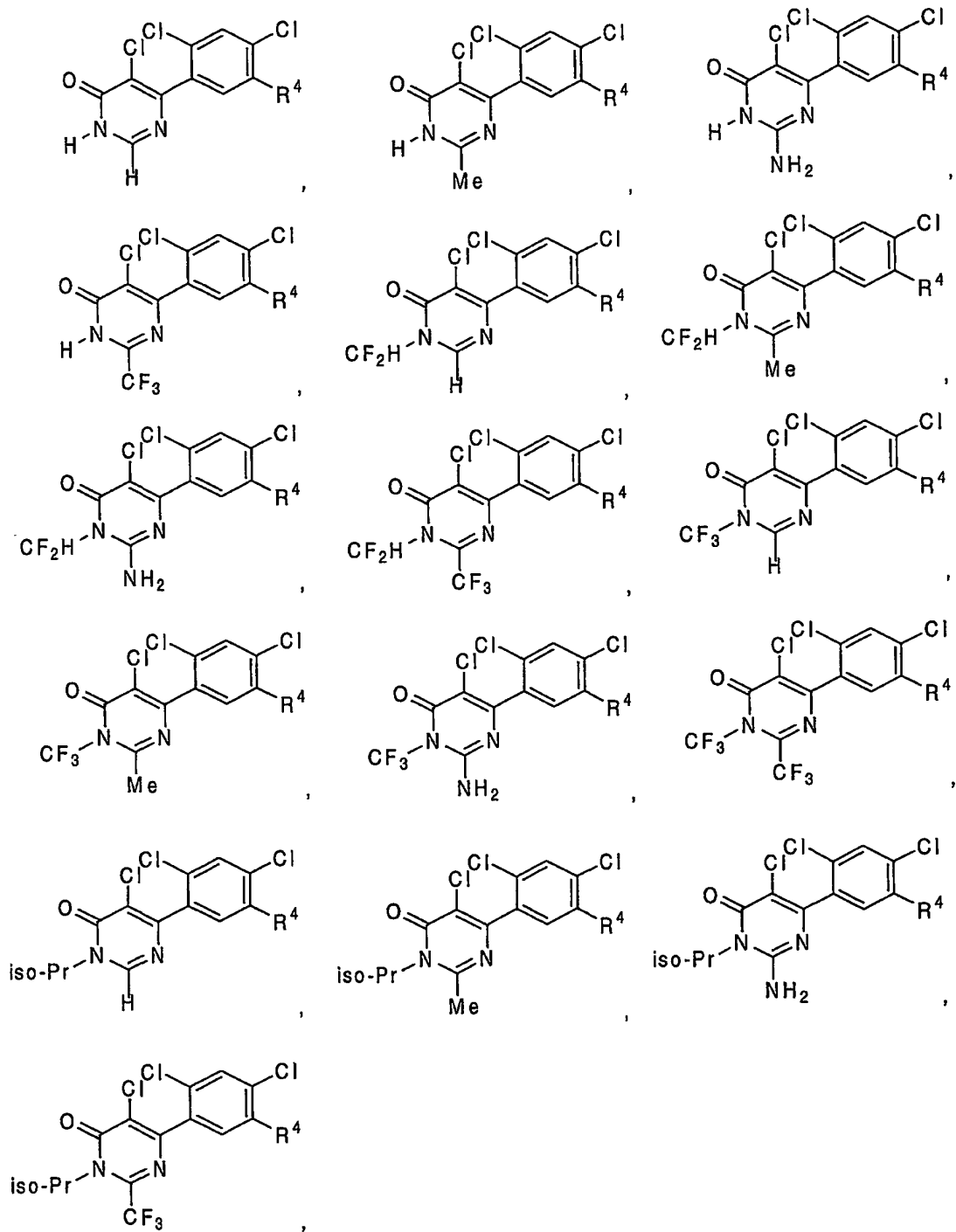


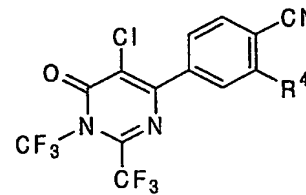
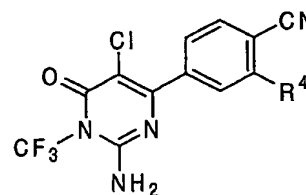
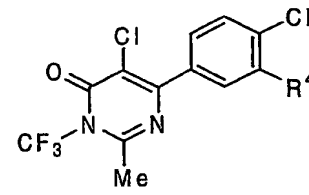
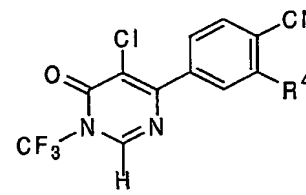
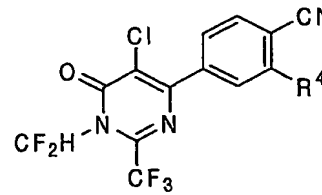
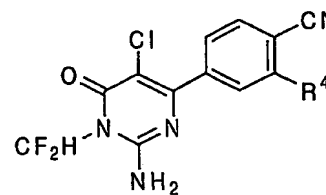
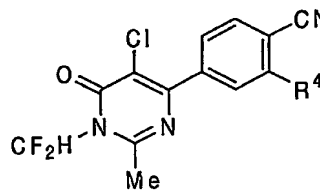
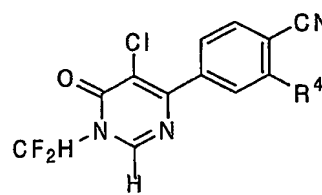
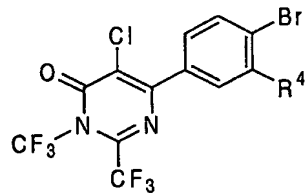
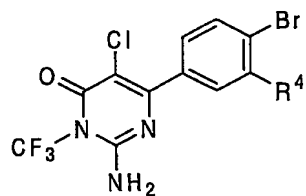
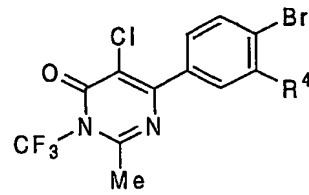
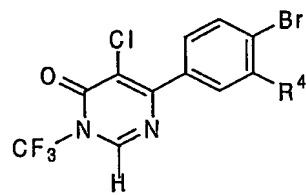
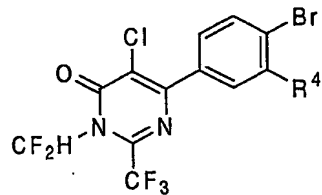
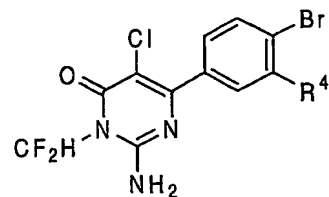
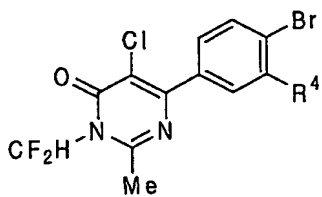
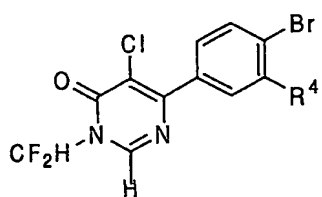


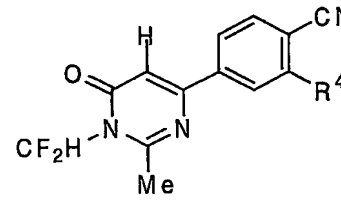
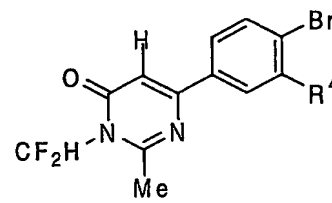
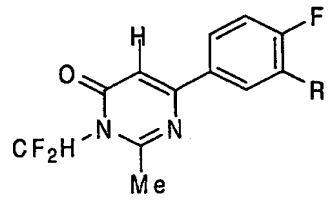
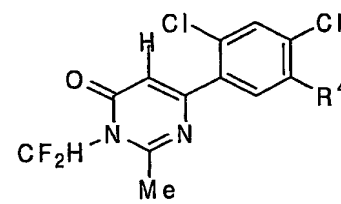
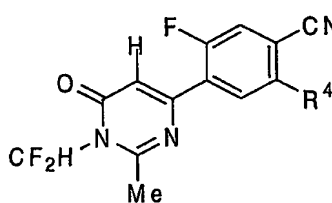
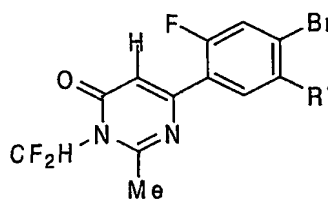
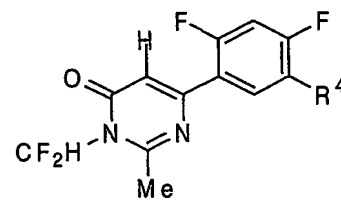
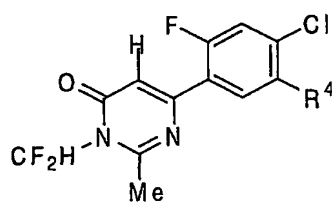
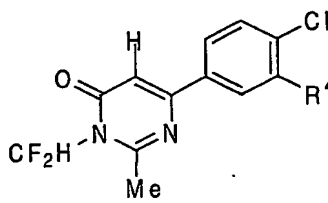
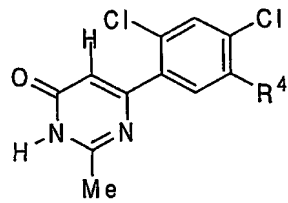
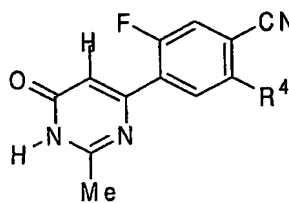
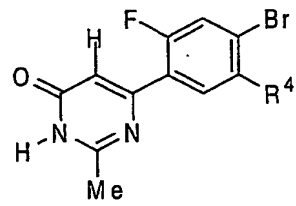
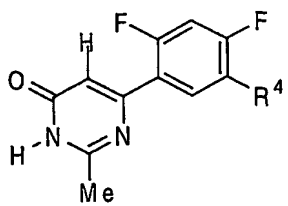
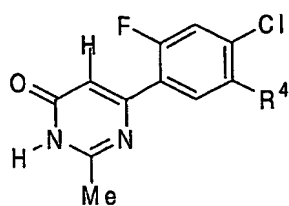


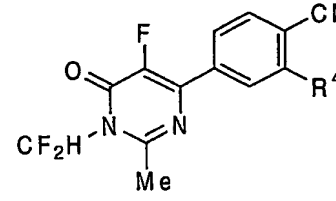
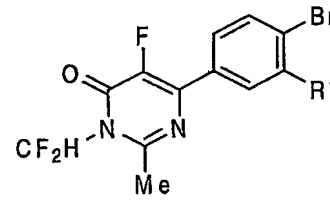
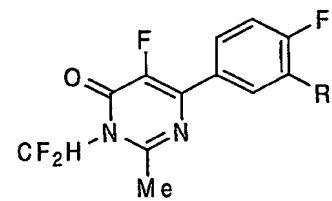
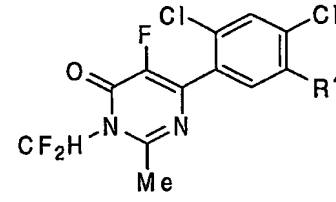
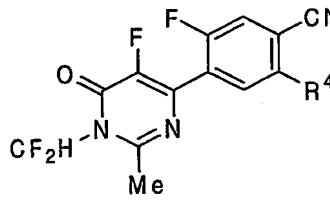
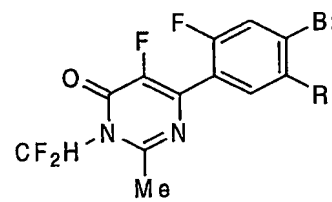
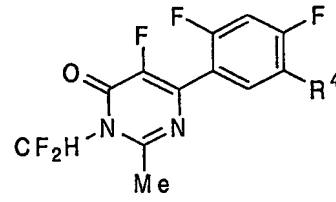
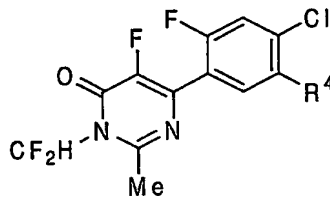
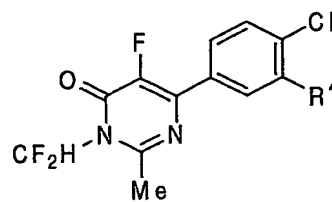
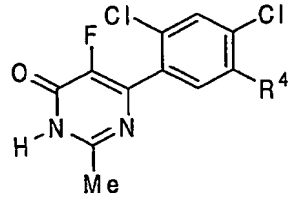
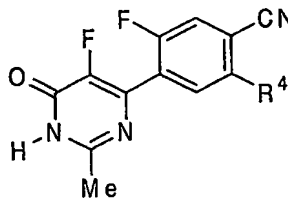
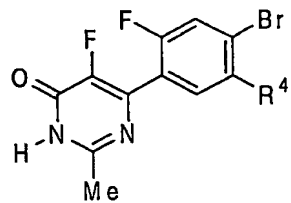
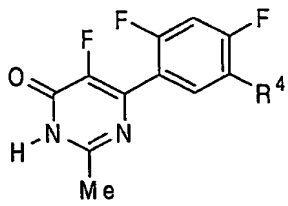
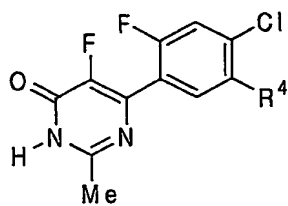


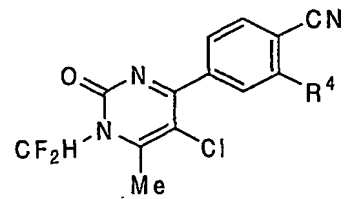
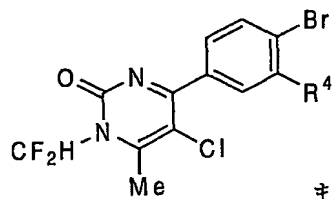
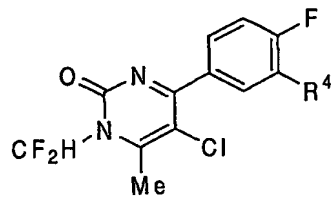
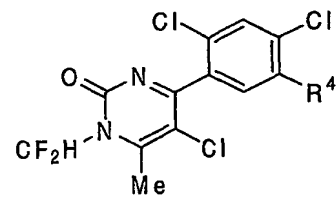
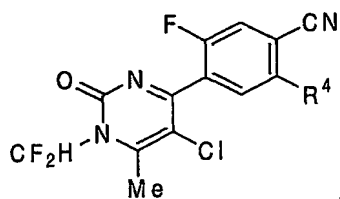
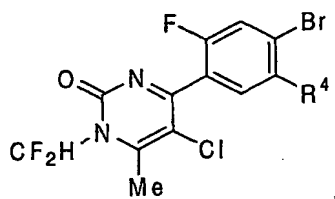
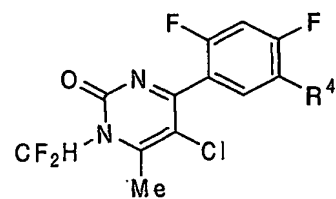
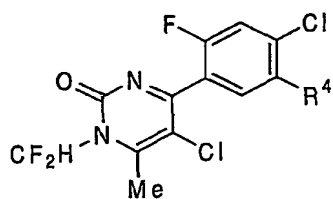
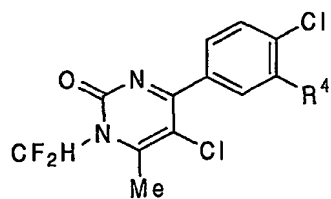
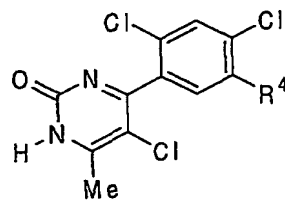
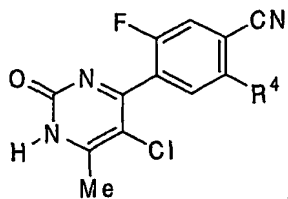
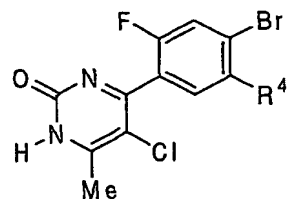
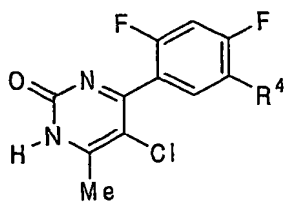
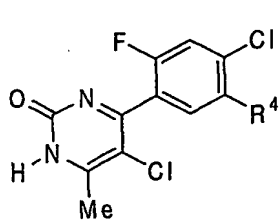












または

R⁴

H、F、Cl、Br、I、CHO、CO₂H、C(O)NH₂、SO₂Cl、C(O)Me、SH、OH、NH₂、NO₂、CN、Ph、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、Pen、neo-Pen、tert-Pen、cyclo-Pr、cyclo-Bu、cyclo-Pen、cyclo-Hex、CH₂CH=CH₂、CH(Me)CH=CH₂、CH₂C≡CH、CH(Me)C≡CH、OMe、OEt、O(iso-Pr)、OPr、OBu、O(sec-Bu)、O(tert-Bu)、O(iso-Bu)、O(cyclo-Pen)、O(cyclo-Pr)、O(cyclo-Hex)、O(neo-Pen)、O(tert-Pen)、OPen、OHex、OHep、OOct、OCH₂Ph、OPh、O(4-Cl-Ph)、O(3-Cl-Ph)、O(2-Cl-Ph)、O(4-Me-Ph)、O(3-Me-Ph)、O(2-Me-Ph)、O(4-MeO-Ph)、O(3-MeO-Ph)、O(2-MeO-Ph)、OCH₂CH=CH₂、OCH₂CH=CHMe、OCHMeCH=CH₂、OCMe₂CH=CH₂、OCH₂C≡CH、OCHMeC≡CH、OCMe₂C≡CH、OCH₂CH=CClH、OCH₂CCl=CH₂、OCHMeCH₂CH=CH₂、OCHMeCH₂C≡CH、CH₂CH₂OMe、OCH₂CH₂OEt、OCH₂CH₂OPr、OCH₂OMe、OCH₂OEt、OCH₂OCH₂Ph、OCH₂O(cyclo-Pen)、OCH₂O(cyclo-Bu)、OCH₂O(cyclo-Pr)、OCH₂O(tert-Bu)、OCH₂O(iso-Bu)、OCH₂O(sec-Bu)、OCH₂OPr、OCH₂O(iso-Pr)、OCH₂OBu、OCH₂CH₂CH₂OMe、OCH₂CH₂CH₂CH₂OMe、OCH₂OCH₂CH₂SiMe₃、OCH(Me)OMe、O-(テトラヒドロピラン-2-イル)、O-(テトラヒドロピラン-3-イル)、O-(テトラヒドロピラン-4-イル)、O-(テトラヒドロフラン-2-イル)、O-(テトラヒドロフラン-3-イル)、O-オキシラニル、OCH₂(cyclo-Pr)、OCH₂(cyclo-Bu)、OCH₂

(c y c l o - P e n) 、 O C H ₂ (c y c l o - H e x) 、 O C H ₂ (1, 5-ジメチルピラゾール-1-イル) 、 O - (2, 3-エポキシプロピル) 、 O C H ₂ C M e = C H ₂ 、 O C H ₂ O C H ₂ C H ₂ O M e 、 O C H ₂ C H ₂ C ≡ C H 、 O C H ₂ (テトラヒドロフラン-2-イル) 、 O C H ₂ (2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) 、 O C H (C H ₂ O E t) ₂ 、 O C H ₂ (テトラヒドロピラン-2-イル) 、 O C H ₂ (フラン-2-イル) 、 O C H ₂ (フラン-3-イル) 、 O C H ₂ (テトラヒドロフラン-3-イル) 、 O C H ₂ (3-メチルオキサタン-3-イル) 、 O C H M e (c y c l o - P r) 、 O C H ₂ C H ₂ O C H = C H ₂ 、 O C H ₂ C ≡ C M e 、 O C H ₂ C H ₂ C H = C H ₂ 、 O C H ₂ C H ₂ C ≡ C M e 、 O C H ₂ C H ₂ C H ₂ C ≡ C H 、 O C H ₂ C H ₂ C M e = C H ₂ 、 O C H ₂ C H ₂ C H ₂ C H = C H ₂ 、 O C H ₂ C H ₂ S M e 、 O C H ₂ C H ₂ O C (O) M e 、 O C H ₂ C H ₂ (モルホリン-1-イル) 、 O C H ₂ C H ₂ (ピロリジン-1-イル) 、 O C H ₂ C H ₂ (2-ピロリドン-1-イル) 、 O - (2-シクロヘキセン-1-イル) 、 O C H ₂ C H ₂ O C H ₂ C H ₂ C l 、 O C H ₂ C H ₂ O C H ₂ C H = C H ₂ 、 O C H ₂ C H ₂ O P h 、 O C H E t C ≡ C H 、 O C H P r C ≡ C H 、 O C H (i s o - B u) C ≡ C H 、 O C H P h C ≡ C H 、 O C H B u C ≡ C H 、 O C H (i s o - P r) C ≡ C H 、 O C H (C H M e P r) C ≡ C H 、 O C H ₂ C ≡ C P h 、 O C H ₂ C ≡ C C H ₂ O M e 、 O C H M e C ≡ C E t 、 O C H ₂ C H = C (M e) ₂ 、 O C H ₂ C H M e C H = C H ₂ 、 O C H ₂ C H ₂ O C H ₂ C ≡ C H 、 O C H E t C H ₂ O C H ₂ C H = C H ₂ 、 O C H M e C H ₂ O E t 、 O C H M e C H ₂ O P r 、 O C H M e C H ₂ O C H ₂ C H = C H ₂ 、 O C H M e C H ₂ O C H ₂ C H = C H M e 、 O C H (C H ₂ C l) C H ₂ O (i s o - P r) 、 O C H (C H ₂ C l) C H ₂ O C H ₂ C H = C H ₂ 、 O C H M e C H ₂ O C H ₂ C H = C H C l 、 O C H M e C H ₂ O C H C l C H = C H ₂ 、 O C H M e C H ₂ O C H ₂ C H ₂ O M e 、 O C H B r C H ₂ O E t 、 O C H (C H ₂ O C H ₂ C H = C H ₂) ₂ 、 O C H E t C H ₂ C H ₂ O E t 、 O (1-メチルピロリジン-3-イル) 、 O C H ₂ C ≡ C C H ₂ C l 、 O C H ₂ C H ₂ O (2-C l - P h) 、 O C H ₂ C H ₂ O C H ₂ C H ₂ O M e 、 O C H E t C H ₂ O M e 、 O C H (C H ₂ F) ₂ 、 O C H ₂ C H ₂ O C H ₂ C H ₂ O C H ₂ C H ₂ C l 、 O C H ₂ C H M e O P h 、 O C H M e C H ₂ O C M e ₃ 、 O C H M e C H ₂ O M e 、 O C H ₂ C

$\text{H}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 OCHEtCH=CH_2 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{OPh}$ 、 OCHMeCH=CH_2 、 OCHMeCH=CHMe 、 $\text{OCH}(\text{CH=CH}_2)_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CHClCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{Br})_2$ 、 $\text{OCHMeCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 OCH_2CHF_2 、 OCH_2CF_3 、 $\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCHPhCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCHPhCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{Me}$ 、 OCH_2CH_2 (オキシラニル)、 O (ピリミジン-2-イル)、 O (4-ブタノリド-2-イル)、 O (2, 3-エポキシプロピル)、 OCH_2CN 、 OCHMeCN 、 $\text{OC}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{Pr}$ 、 $\text{OC}(\text{O})$ (iso-Pr)、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH=CHMe}_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CCl}_3$ 、 $\text{OC}(\text{O})$ (ホルリ-1-イル)、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 OCO_2Me 、 OCO_2Et 、 OCO_2Pr 、 OCO_2 iso-Pr、 OCO_2Ph 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NEt}_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NPr}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CMe=CH}_2$ 、 O (iso-Pen)、 SMe 、 SEt 、 S (iso-Pr)、 SPr 、 SBu 、 S (sec-Bu)、 S (iso-Bu)、 S (cyclo-Pen)、 S (cyclo-Pr)、 S (cyclo-Hex)、 S (neo-Pen)、 S (tert-Pen)、 SPen 、 SHex 、 SHep 、 SOct 、 $\text{SCH}_2\text{CH=CH}_2$ 、 SCHMeCH=CH_2 、 $\text{SCMe}_2\text{CH=CH}_2$ 、 $\text{SCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{SCHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{SCMe}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CH=CClH}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CCl=CH}_2$ 、 SCH_2CF_3 、 $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 SCH_2OMe 、 SCH_2OEt 、 SCH_2 (cyclo-Pr)、 SCH_2CN 、 NHMe 、 NHEt 、 NH (iso-Pr)、 NHPr 、 NHBu 、 NH (sec-Bu)、 NH (iso-Bu)、 NH (cyclo-Pen)、 NH (cyclo-Pr)、 NH (cyclo-Hex)、 NH (neo-Pen)、 NH (tert-Pen)、 NHPen 、 NHHex 、 NHHeP 、 NHOct 、 $\text{NHCH}_2\text{CH=CH}_2$ 、 NHCHMeCH=CH_2 、 $\text{NHCM}_2\text{CH=CH}_2$ 、 $\text{NHCH}_2\text{C}\equiv$

CH 、 $\text{NHCHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{NHCMe}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CClH}$ 、
 $\text{NHCH}_2\text{CCl}=\text{CH}_2$ 、 NHCH_2CF_3 、 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、
 NHCH_2OMe 、 NHCH_2OEt 、 $\text{NHCH}_2(\text{cyclo-Pr})$ 、 NHCH_2CN 、 CO_2Me 、 CO_2Et 、 $\text{CO}_2(\text{iso-Pr})$ 、 CO_2Pr 、
 $\text{CO}_2(\text{cyclo-Pr})$ 、 CO_2Bu 、 $\text{CO}_2(\text{sec-Bu})$ 、 $\text{CO}_2(\text{iso-Bu})$ 、 $\text{CO}_2(\text{tert-Bu})$ 、 $\text{CO}_2(\text{cyclo-Bu})$ 、
 CO_2Pen 、 $\text{CO}_2(\text{cyclo-Pen})$ 、 CO_2Pen 、 $\text{CO}_2(\text{neo-Pen})$ 、 $\text{CO}_2(\text{tert-Pen})$ 、 CO_2Hex 、 $\text{CO}_2(\text{cyclo-Hex})$ 、
 CO_2Hep 、 CO_2Oct 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、
 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CHMeCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、
 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、
 $\text{CO}_2\text{CMe}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 CONMe_2 、 CONEt_2 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、
 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeClCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeClCO}_2\text{Et}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHBrCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClSO}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClSO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2(\text{iso-Pr})$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2(\text{cyclo-Hex})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2(\text{tert-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2(\text{iso-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{Bu}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2(\text{sec-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2$ (テトラヒドロフラン-2-イル)、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})$ (モルホリン-1-イル)、
 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeClC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CMeClC}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCONHOMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHMe}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{iso-Pr})$

、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{iso-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{sec-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{tert-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{cyclo-Pr})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{cyclo-Hex})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHCH}(\text{iso-Pr})\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHNMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{モルホリン-1-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHPh}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{チアゾール-2-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NH}(\text{5-メチルイソキサゾール-3-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHBrC}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMeBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMe}(\text{iso-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMeOMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NEt}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NEtPr}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NEt}(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NEtBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NEt}(\text{tert-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{iso-Pr})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NPr}(\text{sec-Bu})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{iso-Pr})(\text{cyclo-Hex})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)(\text{cyclo-Hex})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)(\text{cyclo-Pen})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMePh}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMe}(\text{ピリジン-2-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{ピロリジン-1-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{チオモルホリン-1-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{4-メチルピペラジン-1-イル})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{N}(\text{cyclo-Hex})\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMeCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CMe}(=\text{NOMe})$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}(=\text{NOMe})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CHMeC}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClCO}_2\text{CH}_2(\text{cyclo-Hex})$

$10-Pr$)、 $CH_2CHClCO_2CH_2CHClCH_2Cl$ 、 $CH_2CHClCO_2CH_2CH=CHMeCl$ 、 $CH_2CHClCO_2CH_2CH_2SMe$ 、 $CH_2CHClCO_2CH_2CO_2Et$ 、 $CH_2CHClCN$ 、 CH_2CCl_2CN 、 $CH_2CH_2CO_2Me$ 、 $CH_2CH_2C(O)NMe_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CO_2Me$ 、 CH_2CO_2Me 、 $CH_2CHMeCO_2Me$ 、 $CH_2(2-クロロブタノリド-2-イル)$ 、 $CH=CHCO_2Me$ 、 $CH=CHCO_2Et$ 、 OCH_2CO_2Me 、 OCH_2CO_2Et 、 $OCH_2CO_2CH_2CF_3$ 、 OCH_2CO_2Pr 、 OCH_2CO_2Bu 、 $CHF CO_2Me$ 、 $OCHF CO_2Et$ 、 $OCHF CO_2Pr$ 、 $OCHF CO_2Bu$ 、 $OCHF CO_2Ph$ 、 $CHCl CO_2Me$ 、 $OCHCl CO_2Et$ 、 $OCHCl CO_2Pr$ 、 $OCCl F CO_2Bu$ 、 $CHBr CO_2Me$ 、 $OCHBr CO_2Et$ 、 $OCHBr CO_2Pr$ 、 $OCHBr CO_2Bu$ 、 $OCF_2 CO_2Me$ 、 $OCF_2 CO_2Et$ 、 $OCF_2 CO_2Pr$ 、 $OCF_2 CO_2Bu$ 、 $OCCl_2 CO_2Me$ 、 $OCCl_2 CO_2Pen$ 、 $OCH_2CO_2(tert-Bu)$ 、 OCH_2CO_2Ph 、 OCH_2CO_2Pen 、 OCH_2CO_2Hex 、 $OCH_2CO_2(cyclo-Pen)$ 、 $OCH_2CO_2(iso-Pr)$ 、 $OCH_2CO_2CH_2Ph$ 、 $OCHMe CO_2Me$ 、 $OCHMe CO_2Et$ 、 $OCHMe CO_2Pr$ 、 $OCHMe CO_2(iso-Pr)$ 、 $OCHMe CO_2Pen$ 、 $OCHMe CO_2(cyclo-Pen)$ 、 $O-(4-ブタノリド-2-イル)$ 、 $O-(5-ペンタノリド-2-イル)$ 、 $O-(6-ヘキサノリド-2-イル)$ 、 $OCH(CO_2Me)_2$ 、 $OCH(CO_2Et)_2$ 、 $OCH(CO_2Pr)_2$ 、 $OCH(CN)CO_2Me$ 、 $OCH(CN)CO_2Et$ 、 $OCMe_2CO_2Me$ 、 $OCMe_2CO_2Et$ 、 $OCMe_2CO_2CH_2CH=CH_2$ 、 $OCMe_2CO_2CH_2C\equiv CH$ 、 $OCHMe CO_2CH_2CH=CH_2$ 、 $OCHMe CO_2CH_2C\equiv CH$ 、 $OCH_2C(O)NMe_2$ 、 $OCH_2C(O)NEt_2$ 、 $OCH_2C(O)(モルホリン-1-イル)$ 、 $OCH_2C(O)NMe(CH_2C\equiv CH)$ 、 $OCH_2C(O)NMe(CH_2CH=CH_2)$ 、 $OCH_2C(O)NHMe$ 、 $CH_2C(O)(ピロリジン-1-イル)$ 、 $OCH_2C(O)(ピペリジン-1-イル)$ 、 $OCH_2C(O)Me$ 、 $OCH_2C(O)Et$ 、 $OCH_2C(O)Pr$ 、 $OCH_2C(O)CH_2OMe$ 、 $OCH_2C(O)(4-Cl-Ph)$ 、 $OCH_2C(O)(4-Br-Ph)$ 、 $OCH_2C(O)(3-Cl-Ph)$ 、 $OCH_2C(O)$

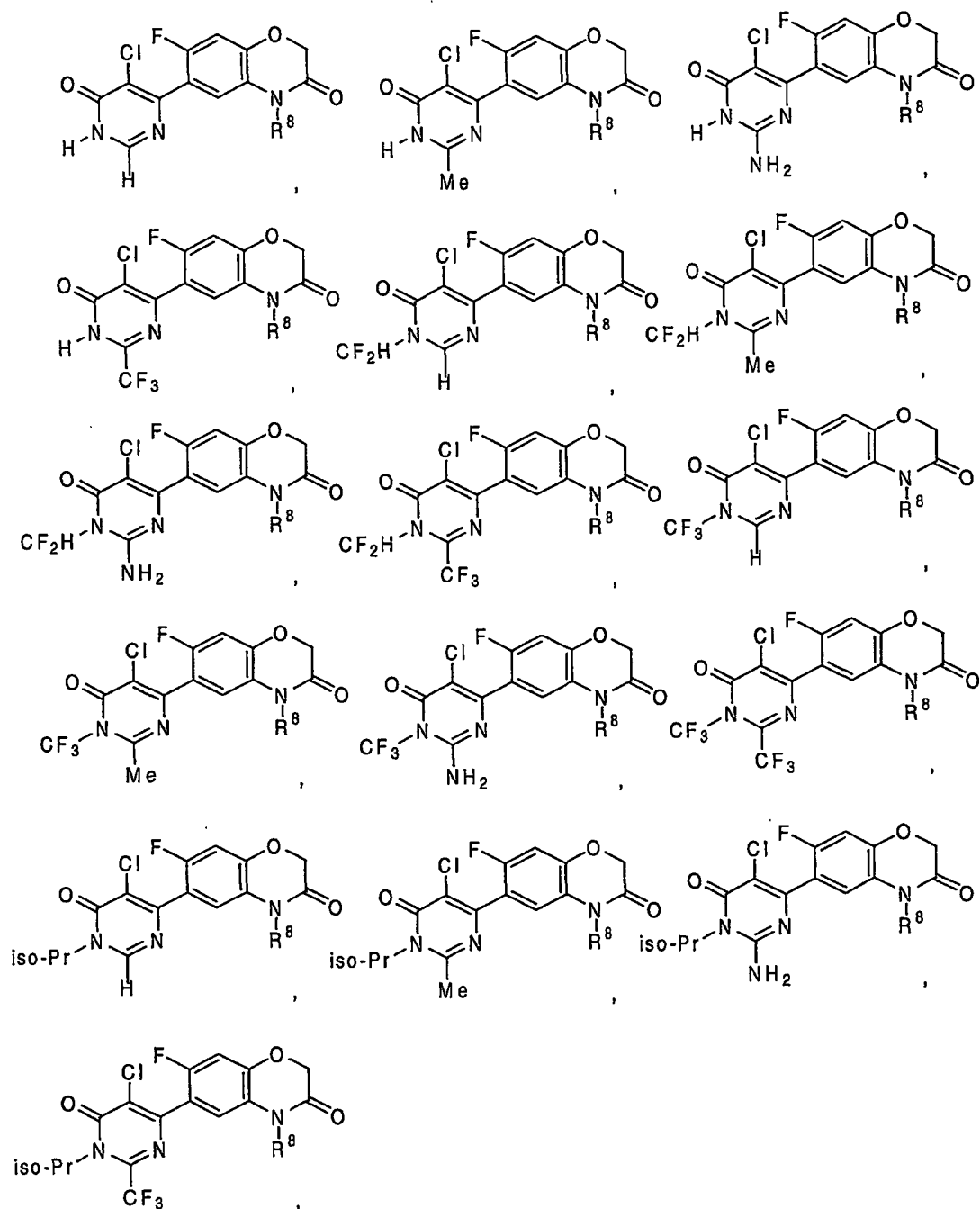
O) (3-Br-Ph)、OCH₂C(O)(2-Cl-Ph)、OCH₂C(O)
 (2-Br-Ph)、OCH₂C(O)Ph、OCH₂CH₂C(O)Ph、O
 CH₂(4-Cl-Ph)、OCH₂(3-Cl-Ph)、OCH₂(2-Cl-
 Ph)、OCH₂(4-CF₃-Ph)、OCH₂(3-CF₃-Ph)、OCH₂
 (2-CF₃-Ph)、OCH₂(4-F-Ph)、OCH₂(3-F-Ph)、
 OCH₂(2-F-Ph)、OCH₂(4-Me-Ph)、OCH₂(3-Me-
 Ph)、OCH₂(2-Me-Ph)、OCH₂(4-MeO-Ph)、OCH₂
 (3-MeO-Ph)、OCH₂(2-MeO-Ph)、OSO₂Me、OSO₂
 CF₃、SCH₂CO₂Me、SCH₂CO₂Et、SCH₂CO₂Pr、SCH₂CO
 2Bu、SCH₂CO₂Pen、SCH₂CO₂Hex、SCH₂CO₂(cyclo
 -Pen)、SCH₂CO₂(iso-Pr)、SCH₂CO₂CH₂Ph、SCH
 MeCO₂Me、SCHMeCO₂Et、SCHMeCO₂Pr、SCHMeCO₂
 (iso-Pr)、SCHMeCO₂Pen、SCHMeCO₂(cyclo-P
 en)、SOCH₂CO₂Me、SOCH₂CO₂Et、SO₂CH₂CO₂Me、S
 O₂CH₂CO₂Et、NHCH₂CO₂Me、NHCH₂CO₂Et、NHCH₂CO
 2Pr、NHCH₂CO₂Bu、NHCH₂CO₂Pen、NHCH₂CO₂Hex、
 NHCH₂CO₂(cyclo-Pen)、NHCH₂CO₂(iso-Pr)、N
 HCH₂CO₂CH₂Ph、NHCHMeCO₂Me、NHCHMeCO₂Et、N
 HCHMeCO₂Pr、NHCHMeCO₂(iso-Pr)、NHCHMeCO
 2Pen、NHCHMeCO₂(cyclo-Pen)、NHCO₂Me、NHC
 O₂Et、NHCO₂Pr、NHCO₂(iso-Pr)、NHCO₂Bu、NHC
 O₂(cyclo-Pr)、NHCO₂(cyclo-Pen)、NHCO₂(i
 so-Bu)、NHCO₂(sec-Bu)、NHCO₂(tert-Bu)、N
 HCO₂CH₂CH=CHCH₃、NHCO₂CH₂CH=CH₂、NHCO₂CH₂C
 ≡CH、NHCO₂Ph、NHCO₂CH₂Ph、NHCO₂CH₂(2-Me-P
 h)、NHCO₂CH₂(3-Me-Ph)、NHCO₂CH₂(4-Me-Ph)
 、NHCO₂CH₂(4-Et-Ph)、NHCO₂CH₂(2-MeO-Ph)、
 NHCO₂CH₂(3-MeO-Ph)、NHCO₂CH₂(4-MeO-Ph)、
 NHCO₂CH₂(4-Cl-Ph)、NHCO₂CH₂(4-F-Ph)、NHC

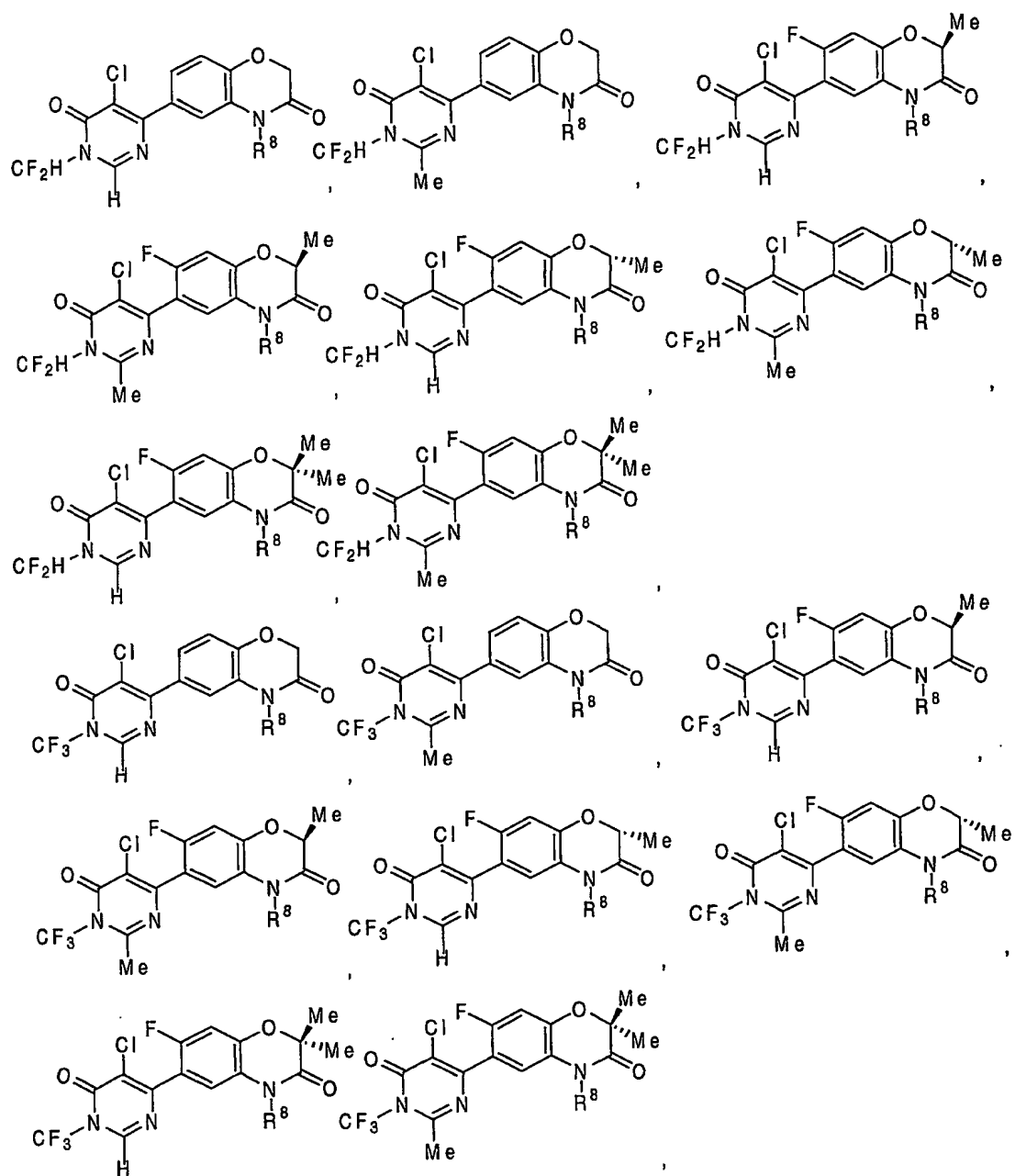
O_2CH_2 (4- CF_3 -Ph)、 NHCO_2CH_2 (2-F-Ph)、 NHCO_2CH_2 (3-F-Ph)、 NHCO_2CH_2 (3-Cl-Ph)、 NHCO_2CH_2 (2-Cl-Ph)、 NHCO_2CH_2 (4- CF_3O -Ph)、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{Pr}$ 、 NHSO_2 (iso-Pr)、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{Bu}$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{CHCl}_2$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{N}\text{HSO}_2\text{Ph}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Et})\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{OMe})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 NMeSO_2Me 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Me})_2$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{CH}_2\text{Cl})_2$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Et})_2$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Pr})_2$ 、 NEtSO_2Et 、 NMeSO_2Et 、 NEtSO_2Et 、 $\text{N}(\text{Pr})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{OMe})\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{OEt})\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CONH}\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CONH}\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CONH}\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、1, 3-ジオキソラン-2-イル、1, 3-ジオキサン-2-イル、4-(EtOC(O)CH₂CH₂O)-PhO、4-(MeOC(O)CH₂CH₂O)-PhO、 NMeCO_2Me 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{NMeC}(\text{O})\text{Me}$ 、 NHCHO 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{Me}$ 、 NHCOPr 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{COMe}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{NMeCO}_2\text{CH}_2$ (4-Me-Ph)、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{CN})\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(\text{tert-Bu}))\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(\text{tert-Bu}))\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(2-\text{MeO-Ph}))\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(3-\text{MeO-Ph}))\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(4-\text{MeO-Ph}))\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(2-\text{MeO-Ph}))\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(3-\text{MeO-Ph}))\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(4-\text{MeO-Ph}))\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(4-\text{Me-Ph}))\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(4-\text{Me-Ph}))\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(4-\text{Cl-Ph}))\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})(4-\text{Cl-Ph}))\text{SO}_2\text{Et}$ 、 CO_2 (オキセタン-3-イル)、 $\text{N}(\text{CHO})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{CHO})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CHO})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{N}(\text{CHO})\text{CHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{CHO})\text{CHMeC}$

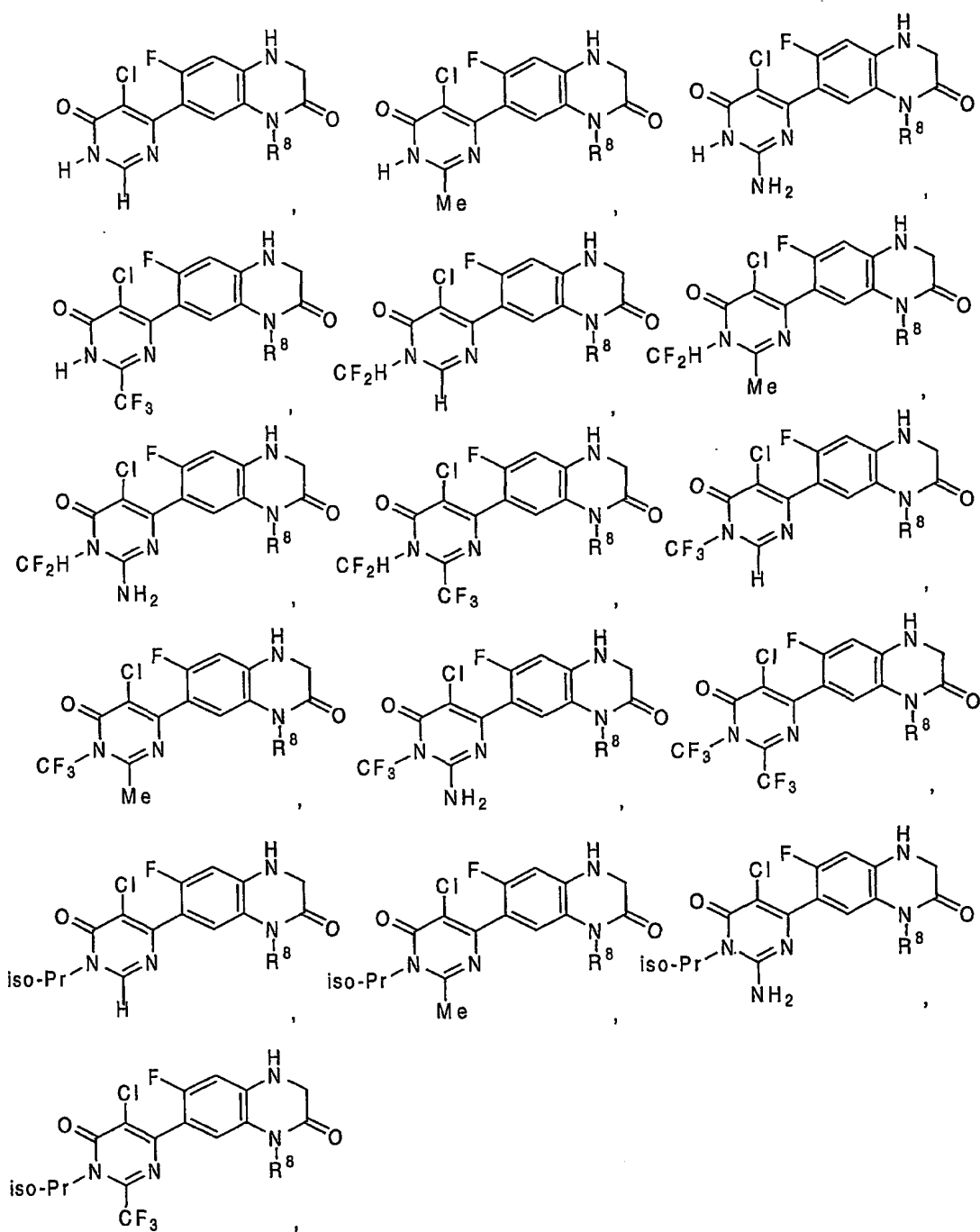
O_2Et 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Pen}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{CHMeCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{C}(\text{O})\text{Me})\text{CHMeCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2\text{CN})\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Me})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Me})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Et})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{N}(\text{SO}_2\text{Et})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 CF_3 、 CF_2H 、 CH_2Cl 、 CH_2Br 、 CHBr_2 、 CH_2OH 、 CHBrEt 、 $\text{CH}_2\text{CHClCH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}(\text{OH})\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}(\text{OH})\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClOC}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{CH}(\text{CO}_2\text{Me})_2$ 、 $\text{CH}(\text{CO}_2\text{Et})_2$ 、 $\text{CH}(\text{CN})\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}(\text{CN})\text{CO}_2\text{Et}$ 、 CH_2CN 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $\text{CH}=\text{CHCN}$ 、 CMe_2CN 、 CH_2NMe_2 、 CH_2NEt_2 、 CH_2NPr_2 、 CH_2SMe 、 CH_2SEt 、 CH_2SPr 、 $\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 CH_2OMe 、 CH_2OEt 、 CH_2OPr 、 $\text{CH}_2\text{O}(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{Pr}$ 、 $\text{C}(\text{O})(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OMe})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OEt})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OPr})$ 、 $\text{CH}=\text{N}(\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHMe}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHEt}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHPr}$ 、 $\text{CH}=\text{CClCO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}=\text{CClCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClP}(\text{O})(\text{OMe})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClP}(\text{O})(\text{OEt})_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 OCH_2SMe 、 OCF_3 、 OCF_2H 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}(\text{CN})\text{CH}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CMe}=\text{CH}_2$ 、 OPh 、 $\text{O}-(\text{ピリジン}-2\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(\text{ピリジン}-4\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(5\text{-CF}_3\text{-3-Cl-ピリジン}-2\text{-イル})$ 、 $\text{O}-(5\text{-CF}_3\text{-ピリジン}-2\text{-イル})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Me-2-(MeOC}(\text{O})\text{CHMeO})\text{-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Cl-2-(MeOC}(\text{O})\text{CHMeO})\text{-Ph})$ 、 $5\text{-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ}$ 、 $5\text{-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ}$ 、 2-ピリミジニルオキシ 、 2-ピリジルオキシ 、 4-ピリジルオキシ 、 5-クロロ-2-ピリジルオキシ 、 $6\text{-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ}$ 、 $3\text{-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ}$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(MeOCH}_2\text{O)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(MeOCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO)-Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-(EtOCH}_2\text{O)-Ph})$

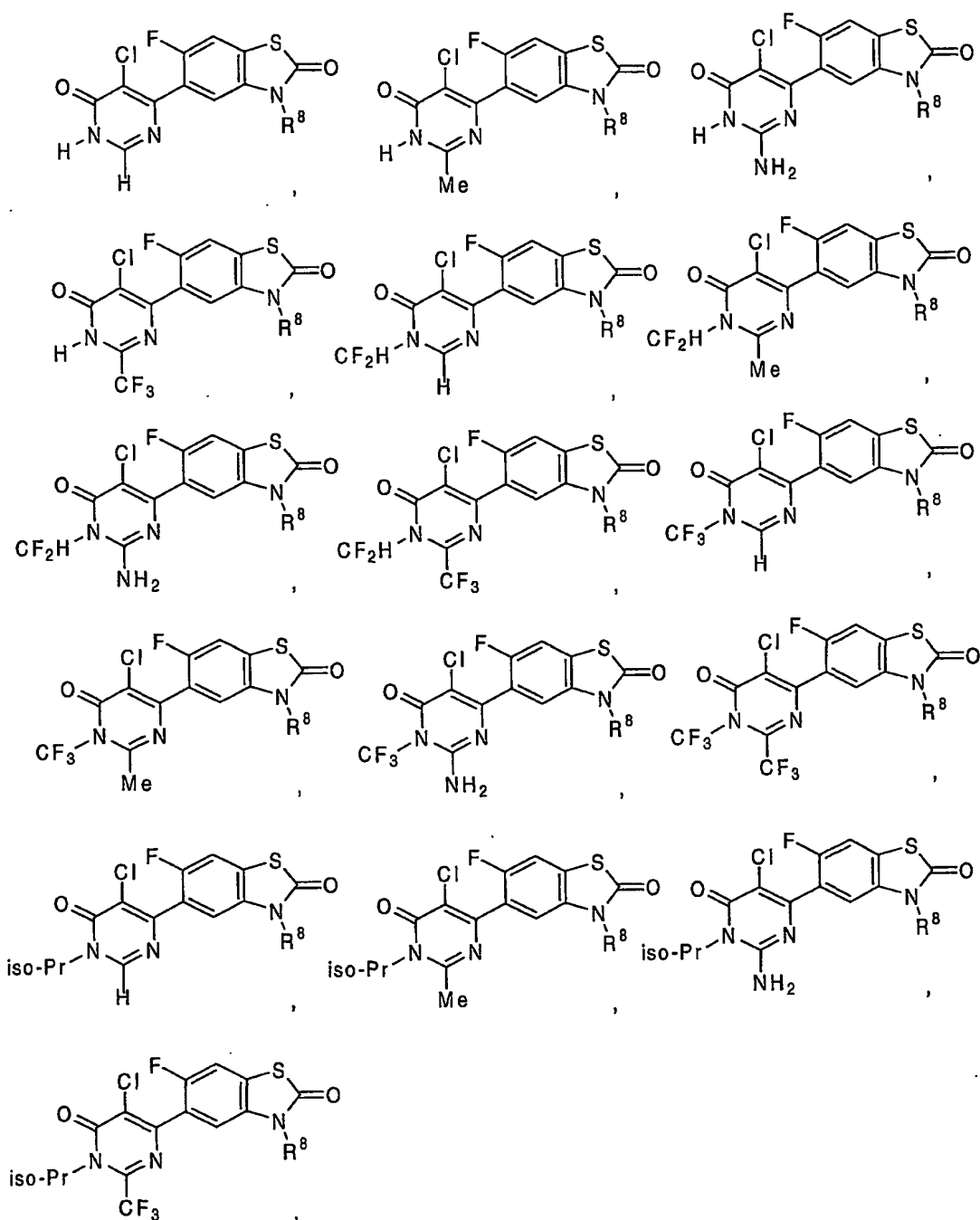
${}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{MeOCH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{EtOCH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{EtOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{MeOCH}_2\text{CHMeOC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{FCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{OCH}_2(4-(\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CHMeO})-\text{Ph})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OC}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OC}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OC}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OSO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{OP}(\text{O})(\text{OEt})_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NNMe}_2)\text{O}(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NNMe}_2)\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NNMe}_2)\text{OC}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NSO}_2\text{Me})\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CHClC}(=\text{NOMe})\text{NMe}_2$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OMe}$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{O}(\text{iso-Pr})$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OC}(\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OC}(\text{O})\text{Et}$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OC}(\text{O})\text{NMe}_2$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OSO}_2\text{Me}$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{OP}(\text{O})(\text{OEt})_2$ 、 $\text{C}(=\text{NOCH}_2=\text{CHCH}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{C}(=\text{NOCH}_2\text{CH}_2\text{SiMe}_3)\text{OMe}$ 、 $\text{C}(=\text{NO}(\text{テトラヒドロピラン-2-イル}))\text{OMe}$ 、 $\text{C}(=\text{NNMe}_2)\text{OMe}$ 、 $\text{C}(=\text{NSO}_2\text{Me})\text{OMe}$ 、 $\text{C}(=\text{NOMe})\text{NMe}_2$ 、2-ピリジル、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル、フラン-2-イル、チオフェン-2-イル、5-クロロチオフェン-2-イル、4-メチル-1,3-オキサゾール-2-イル、 $\text{CH}(\text{CH}_2\text{Cl})\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ または $\text{CH}_2\text{CHClC}(\text{O})\text{NMe}(\text{iso-Pr})$

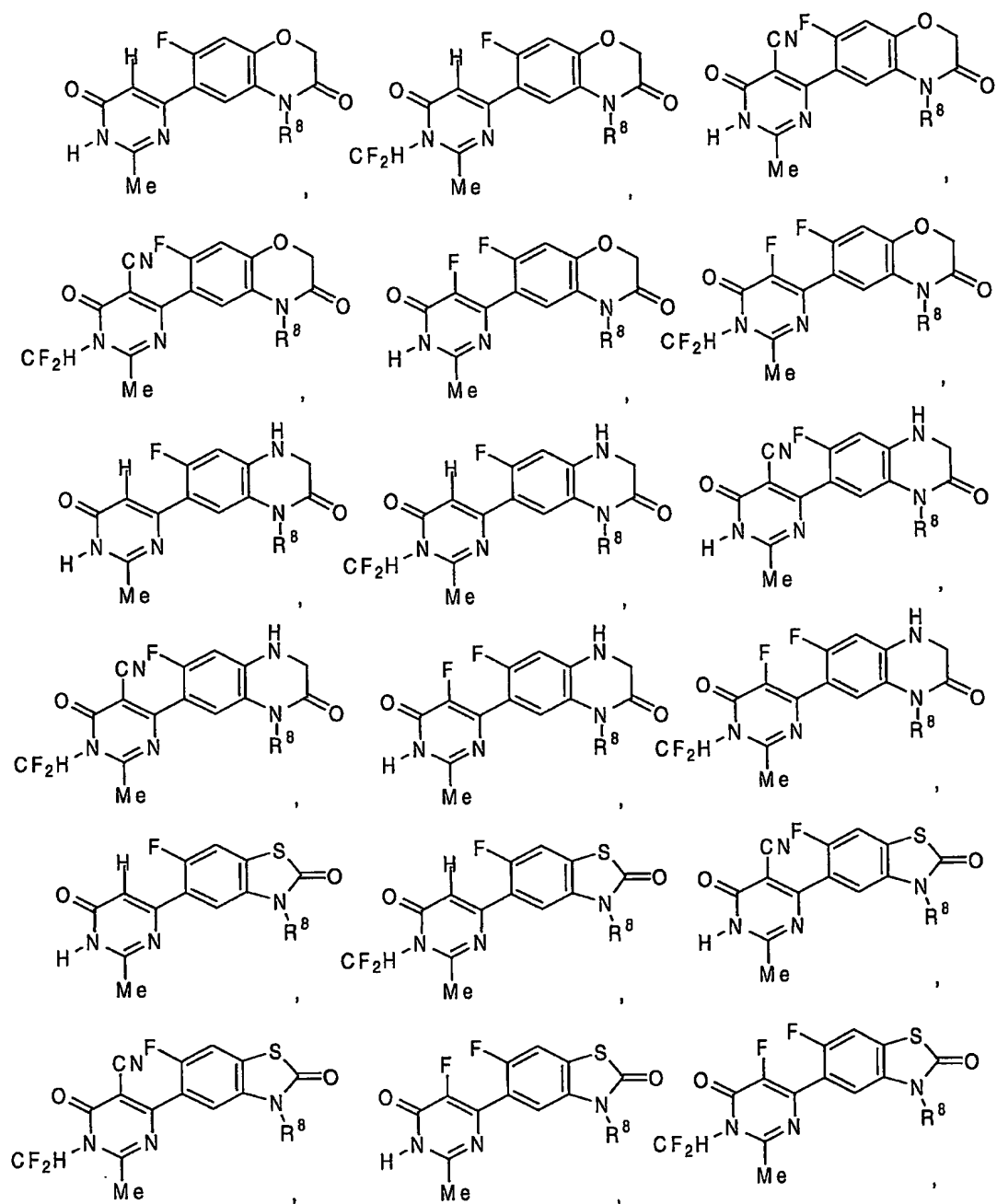
〔第5表〕

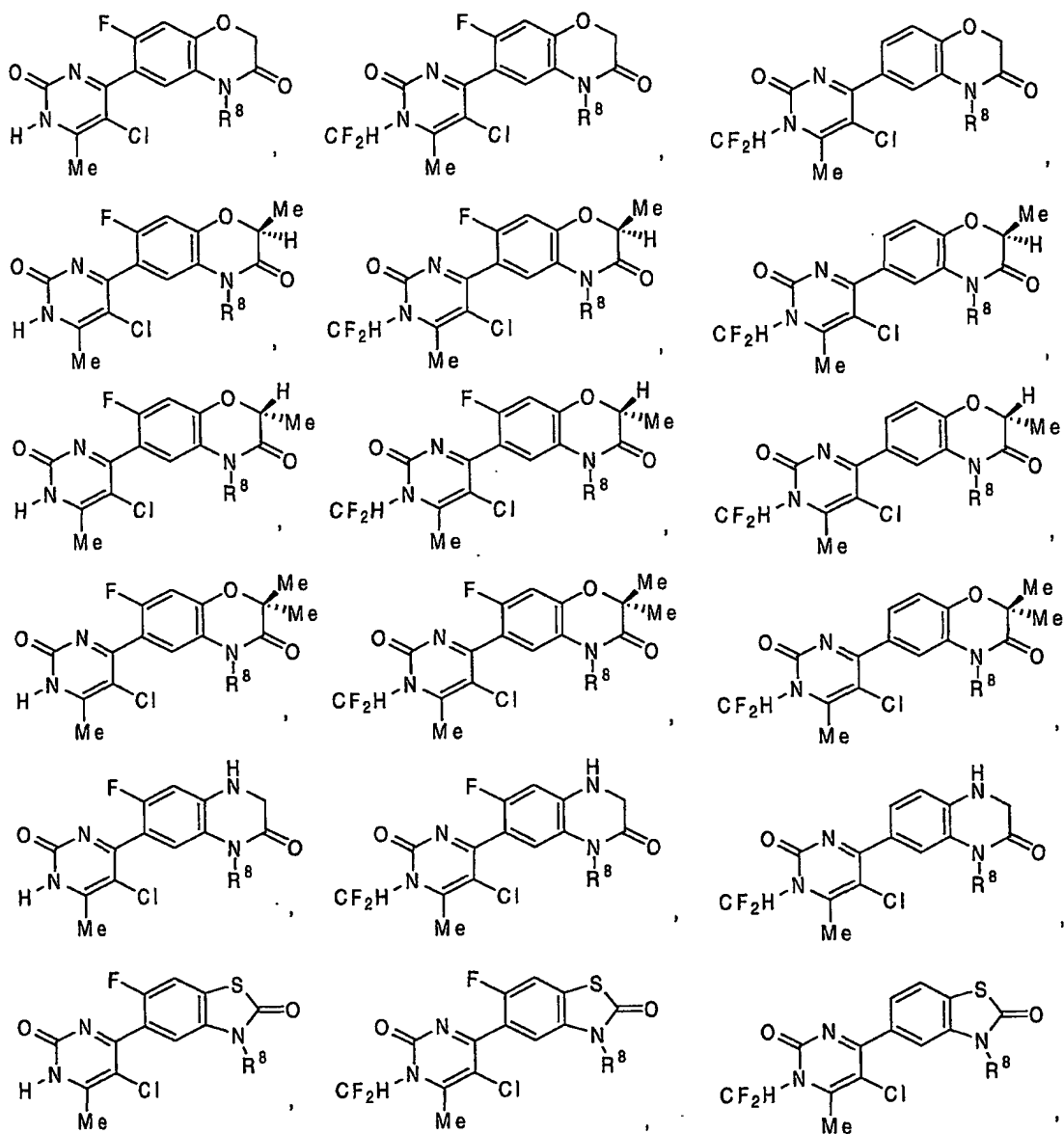


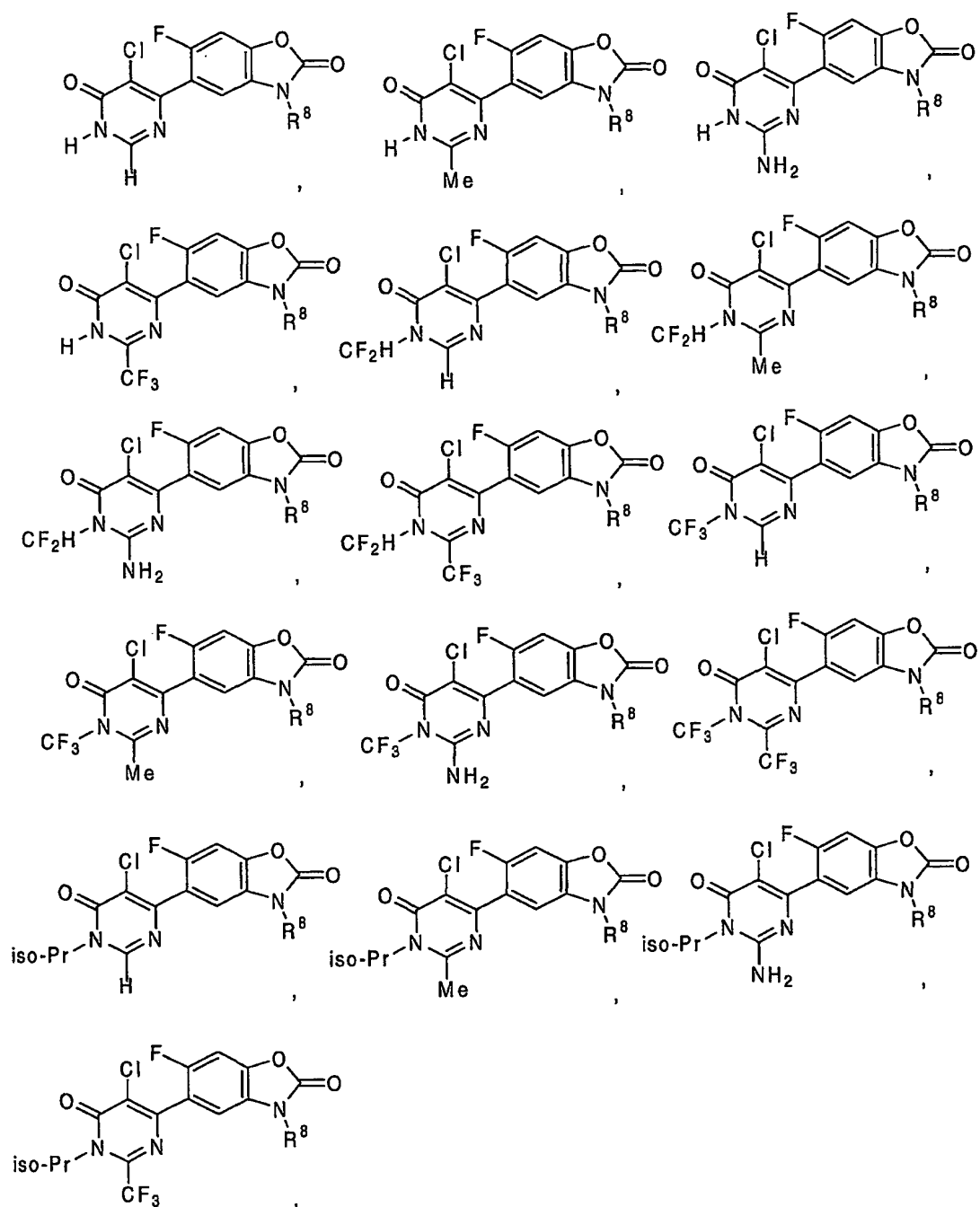


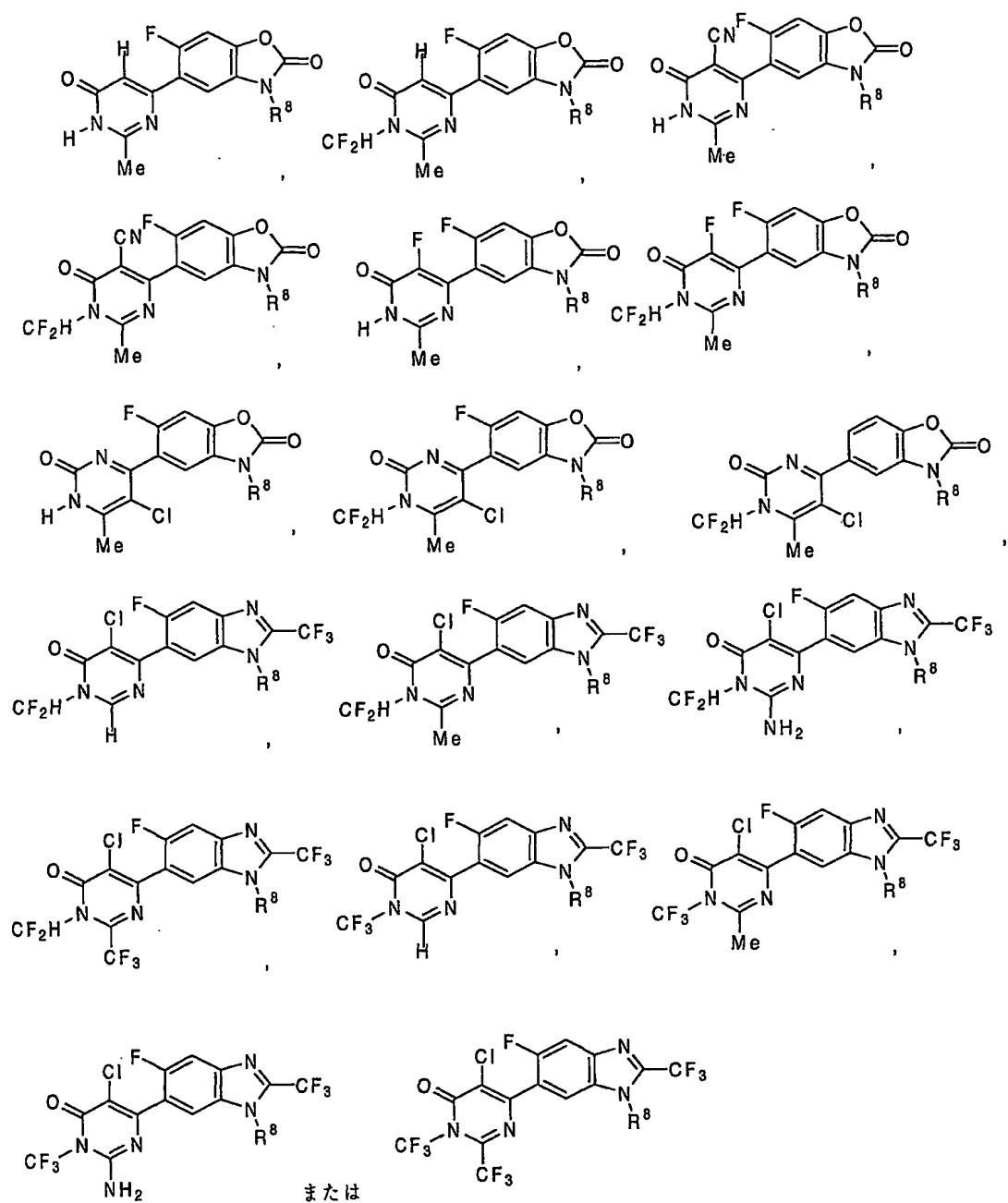








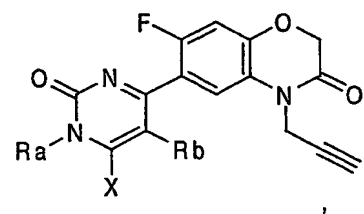
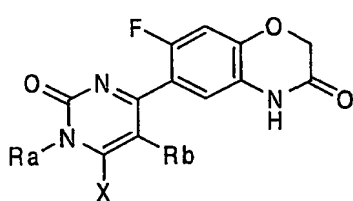
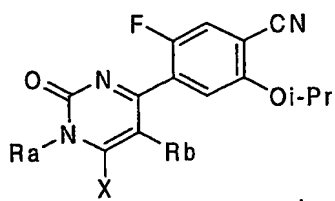
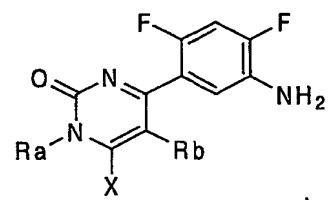
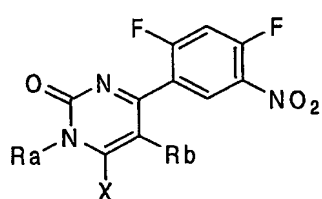
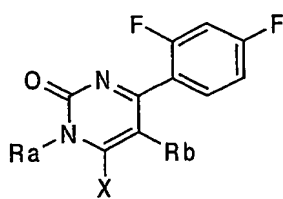
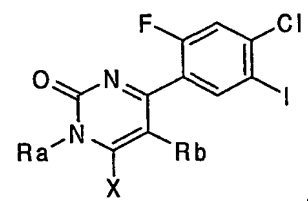
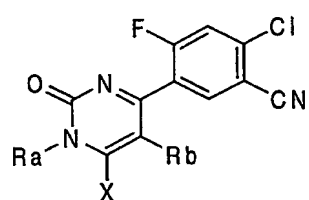
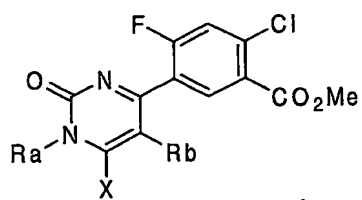
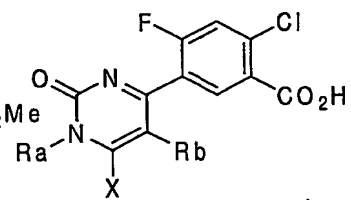
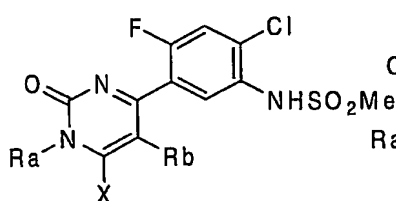
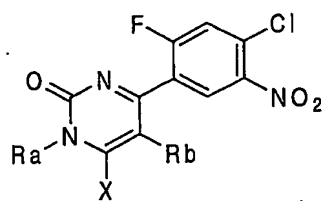
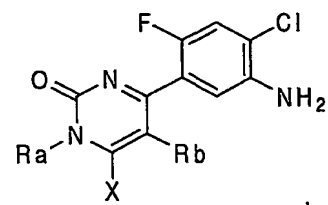
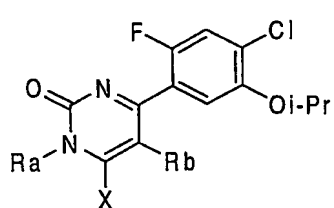
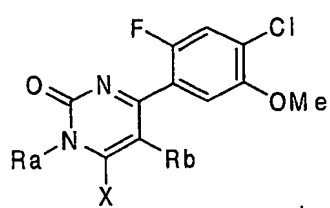




$$R^8$$

H、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、 $CH_2CH=CH_2$ 、 $CH_2C\equiv CH$ 、 $CH_2C\equiv N$ 、 CH_2CH_2F 、 CH_2CH_2Cl 、 $CH_2CH_2CH_2F$ 、 CO_2Me 、 CO_2Et 、 CO_2Pr 、 $CO_2(tert-Bu)$ 、 SO_2Me 、 SO_2Et 、 SO_2Pr 、 CH_2OMe 、 CH_2OEt 、 $CH_2CH_2CH_2Cl$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2F$ 、 $CH_2CCl=CH_2$ 、 $CH_2CBr=CH_2$ 、 $CHMeC\equiv CH$ 、 $CHMeC=CH_2$ 、 OMe 、 OEt 、 OPr 、 $H(Me)C\equiv N$ 、 CH_2CO_2Me 、 CH_2CO_2Et 、 $CH_2CO_2(iso-Pr)$ 、 CH_2CONH_2 、 $CH_2CONHMe$ 、 CH_2CONMe_2 、 $CHMeCO_2Me$ 、 $CHMeCO_2Et$ 、 $CHMeCO_2(iso-Pr)$ 、 $CHMeCONH_2$ 、 $CHMeCONHMe$ 、 $CHMeCONMe_2$ 、 $CH_2C(=NOMe)OMe$ 、 $CH_2C(=NOMe)OCH_2CO_2Me$ 、 $CH_2C(=NNMe_2)OMe$ 、 $CHMeC(=NOMe)OMe$ 、 $CHMeC(=NOMe)OCH_2CO_2Me$ 、 $CHMeC(=NNMe_2)OMe$ 、 OCH_2CO_2Me 、 OCH_2CO_2Et 、 $OCH_2CO_2(iso-Pr)$ 、 OCH_2CONH_2 、 $OCH_2CONHMe$ 、 OCH_2CONMe_2 、 $OCHMeCO_2Me$ 、 $OCHMeCO_2Et$ 、 $OCHMeCO_2(iso-Pr)$ 、 $OCHMeCONH_2$ 、 $OCHMeCONHMe$ 、 $OCHMeCONMe_2$ 、 $OCH_2C(=NOMe)OMe$ 、 $OCH_2C(=NOMe)OCH_2CO_2Me$ 、 $OCH_2C(=NNMe_2)OMe$ 、 $OCHMeC(=NOMe)OMe$ 、 $OCHMeC(=NOMe)OCH_2CO_2Me$ 、 $OCHMeC(=NNMe_2)OMe$ 、 $OCH_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $OCH_2C\equiv N$ 、 OCH_2CH_2F 、 $OCH_2CH_2CH_2F$ 、 OCH_2OCH_3 、 $OCHMeCH=CH_2$ 、 $OCHMeC\equiv CH$ または $OCHMeC\equiv N$

〔第6表〕



R b	R a	X
H	H	H
H	H	NH ₂
H	H	Et
H	H	iso-Pr
H	H	CF ₃
H	H	OMe
H	H	OCF ₂ H
H	H	SMe
H	H	SO ₂ Me
H	H	NHMe
H	H	NMe ₂
H	Me	H
H	Me	Me
H	Me	NH ₂
H	Me	Et
H	Me	iso-Pr
H	Me	CF ₃
H	Me	OMe
H	Me	OCF ₂ H
H	Me	SMe
H	Me	SO ₂ Me
H	Me	NHMe
H	Me	NMe ₂
H	Et	H
H	Et	Me
H	Et	NH ₂
H	Et	Et
H	Et	iso-Pr
H	Et	CF ₃
H	Et	OMe
H	Et	OCF ₂ H
H	Et	SMe
H	Et	SO ₂ Me
H	Et	NHMe
H	Et	NMe ₂
H	iso-Pr	H
H	iso-Pr	Me
H	iso-Pr	NH ₂
H	iso-Pr	Et
H	iso-Pr	iso-Pr
H	iso-Pr	CF ₃
H	iso-Pr	OMe
H	iso-Pr	OCF ₂ H
H	iso-Pr	SMe
H	iso-Pr	SO ₂ Me
H	iso-Pr	NHMe
H	iso-Pr	NMe ₂
H	CF ₂ H	H
H	CF ₂ H	Me
H	CF ₂ H	NH ₂
H	CF ₂ H	Et
H	CF ₂ H	iso-Pr
H	CF ₂ H	CF ₃
H	CF ₂ H	OMe
H	CF ₂ H	OCF ₂ H
H	CF ₂ H	SMe
H	CF ₂ H	SO ₂ Me
H	CF ₂ H	NHMe
H	CF ₂ H	NMe ₂
H	CF ₂ H	H
H	CF ₂ H	Me
H	CF ₂ H	NH ₂
H	CF ₂ H	Et
H	CF ₂ H	iso-Pr
H	CF ₂ H	CF ₃
H	CF ₂ H	OMe
H	CF ₂ H	OCF ₂ H

[illegible][illegible]

SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe

H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
H
F
F
F
F
F
F
F
F
F
F
F
F
F

CH_2OMe
 CH_2OMe
 CH_2OMe
 CH_2OMe
 CH_2OMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 CH_2SMe
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 CH_2CN
 H
 H
 H
 H
 H
 H
 H
 H
 H
 Me
 Me
 Me
 Me
 Me

OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3

FFFFFFFFFFF

[illegible]

OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr

[illegible]

M e S O₂
M e S O₂
M e S O₂
M e S O₂
M e S O₂
M e S O₂
M e S O₂
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
M e O₂ C
C N
C N
C N
C N
C N
C N
C N
C N
C N
C N
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ O M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S M e
C H₂ S O₂ M e
C H₂ S O₂ M e
C H₂ S O₂ M e

CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 CN
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2

[illegible][illegible]

E t
i s o - P r
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
H
Me
 NH_2
E t
i s o - P r
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
H
Me
 NH_2
E t
i s o - P r
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
H
Me
 NH_2
E t
i s o - P r
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
H

C l	i s o - P r	M e
C l	i s o - P r	NH ₂
C l	i s o - P r	E t
C l	i s o - P r	i s o - P r
C l	i s o - P r	CF ₃
C l	i s o - P r	OMe
C l	i s o - P r	OCF ₂ H
C l	i s o - P r	SMe
C l	i s o - P r	SO ₂ Me
C l	i s o - P r	NHMe
C l	i s o - P r	NMe ₂
C l	CF ₂ H	E t
C l	CF ₂ H	i s o - P r
C l	CF ₂ H	OMe
C l	CF ₂ H	OCF ₂ H
C l	CF ₂ H	SMe
C l	CF ₂ H	SO ₂ Me
C l	CF ₂ H	NHMe
C l	CF ₂ H	NMe ₂
C l	CF ₃	E t
C l	CF ₃	i s o - P r
C l	CF ₃	OMe
C l	CF ₃	OCF ₂ H
C l	CF ₃	SMe
C l	CF ₃	SO ₂ Me
C l	CF ₃	NHMe
C l	CF ₃	NMe ₂
C l	MeSO ₂	H
C l	MeSO ₂	Me
C l	MeSO ₂	NH ₂
C l	MeSO ₂	E t
C l	MeSO ₂	i s o - P r
C l	MeSO ₂	CF ₃
C l	MeSO ₂	OMe
C l	MeSO ₂	OCF ₂ H
C l	MeSO ₂	SMe
C l	MeSO ₂	SO ₂ Me
C l	MeSO ₂	NHMe
C l	MeSO ₂	NMe ₂
C l	MeO ₂ C	H
C l	MeO ₂ C	Me
C l	MeO ₂ C	NH ₂
C l	MeO ₂ C	E t
C l	MeO ₂ C	i s o - P r
C l	MeO ₂ C	CF ₃
C l	MeO ₂ C	OMe
C l	MeO ₂ C	OCF ₂ H
C l	MeO ₂ C	SMe
C l	MeO ₂ C	SO ₂ Me
C l	MeO ₂ C	NHMe
C l	MeO ₂ C	NMe ₂
C l	CN	H
C l	CN	Me
C l	CN	NH ₂
C l	CN	CN
C l	CN	i s o - P r
C l	CN	CF ₃
C l	CN	OMe

Cl	CN	OCF ₂ H
Cl	CN	SM _e
Cl	CN	SO ₂ Me
Cl	CN	NHMe
Cl	CN	NMe ₂
Cl	CH ₂ OM _e	H
Cl	CH ₂ OM _e	Me
Cl	CH ₂ OM _e	NH ₂
Cl	CH ₂ OM _e	Et
Cl	CH ₂ OM _e	iso-Pr
Cl	CH ₂ OM _e	CF ₃
Cl	CH ₂ OM _e	OM _e
Cl	CH ₂ OM _e	OCF ₂ H
Cl	CH ₂ OM _e	SM _e
Cl	CH ₂ OM _e	SO ₂ Me
Cl	CH ₂ OM _e	NHMe
Cl	CH ₂ OM _e	NMe ₂
Cl	CH ₂ SM _e	H
Cl	CH ₂ SM _e	Me
Cl	CH ₂ SM _e	NH ₂
Cl	CH ₂ SM _e	Et
Cl	CH ₂ SM _e	iso-Pr
Cl	CH ₂ SM _e	CF ₃
Cl	CH ₂ SM _e	OM _e
Cl	CH ₂ SM _e	OCF ₂ H
Cl	CH ₂ SM _e	SM _e
Cl	CH ₂ SM _e	SO ₂ Me
Cl	CH ₂ SM _e	NHMe
Cl	CH ₂ SM _e	NMe ₂
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	H
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	Me
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	NH ₂
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	Et
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	iso-Pr
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	OM _e
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	OCF ₂ H
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	SM _e
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ Me
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	NHMe
Cl	CH ₂ SO ₂ Me	NMe ₂
Cl	CH ₂ CN	H
Cl	CH ₂ CN	Me
Cl	CH ₂ CN	NH ₂
Cl	CH ₂ CN	Et
Cl	CH ₂ CN	iso-Pr
Cl	CH ₂ CN	CF ₃
Cl	CH ₂ CN	OM _e
Cl	CH ₂ CN	OCF ₂ H
Cl	CH ₂ CN	SM _e
Cl	CH ₂ CN	SO ₂ Me
Cl	CH ₂ CN	NHMe
Cl	CH ₂ CN	NMe ₂
Br	H	H
Br	H	Me
Br	H	NH ₂
Br	H	Et
Br	H	iso-Pr

[illegible][illegible]

CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2

[illegible][illegible]

Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H
Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H
Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H
Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H

[illegible][illegible]

Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe

[illegible][illegible]

NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe

[illegible][illegible]

SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 CN
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe

I	CH ₂ SO ₂ Me	OCF ₂ H
I	CH ₂ SO ₂ Me	SMe
I	CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ Me
I	CH ₂ SO ₂ Me	NHMe
I	CH ₂ SO ₂ Me	NMe ₂
I	CH ₂ CN	H
I	CH ₂ CN	Me
I	CH ₂ CN	NH ₂
I	CH ₂ CN	Et
I	CH ₂ CN	iso-Pr
I	CH ₂ CN	CF ₃
I	CH ₂ CN	OMe
I	CH ₂ CN	OCF ₂ H
I	CH ₂ CN	SMe
I	CH ₂ CN	SO ₂ Me
I	CH ₂ CN	NHMe
I	CH ₂ CN	NMe ₂
MeO	H	H
MeO	H	Me
MeO	H	NH ₂
MeO	H	Et
MeO	H	iso-Pr
MeO	H	CF ₃
MeO	H	OMe
MeO	H	OCF ₂ H
MeO	H	SMe
MeO	H	SO ₂ Me
MeO	H	NHMe
MeO	H	NMe ₂
MeO	Me	H
MeO	Me	Me
MeO	Me	NH ₂
MeO	Me	Et
MeO	Me	iso-Pr
MeO	Me	CF ₃
MeO	Me	OMe
MeO	Me	OCF ₂ H
MeO	Me	SMe
MeO	Me	SO ₂ Me
MeO	Me	NHMe
MeO	Me	NMe ₂
MeO	Et	H
MeO	Et	Me
MeO	Et	NH ₂
MeO	Et	Et
MeO	Et	iso-Pr
MeO	Et	CF ₃
MeO	Et	OMe
MeO	Et	OCF ₂ H
MeO	Et	SMe
MeO	Et	SO ₂ Me
MeO	Et	NHMe
MeO	Et	NMe ₂
MeO	Et	H
MeO	iso-Pr	Me
MeO	iso-Pr	NH ₂
MeO	iso-Pr	Et
MeO	iso-Pr	iso-Pr
MeO	iso-Pr	

[illegible][illegible]

CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2

[illegible][illegible]

Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H
Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H
Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe
NMe₂
H
Me
NH₂
Et
iso-Pr
CF₃
OMe
OCF₂H
SMe
SO₂Me
NHMe

[illegible][illegible]

NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe

[illegible]

C H₂O M e
C H₂O M e
C H₂O M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂S O₂M e
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
C H₂C N
H
H
H
H
H
H
H
H
M e
M e
M e
M e
M e
M e
M e

SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H
 SMe
 SO_2Me
 NHMe
 NMe_2
 H
 Me
 NH_2
 Et
 iso-Pr
 CF_3
 OMe
 OCF_2H

[illegible][illegible]

SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe
 OCF₂H
 SMe
 SO₂Me
 NHMe
 NMe₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso-Pr
 CF₃
 OMe

[illegible]

MeSO₂
MeSO₂
MeSO₂
MeSO₂
MeSO₂
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
MeO₂C
CN
CN
CN
CN
CN
CN
CN
CN
CN
CN
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂OMe
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SM e
CH₂SO₂Me
CH₂SO₂Me
CH₂SO₂Me
CH₂SO₂Me

OC F₂ H
 S Me
 SO₂ Me
 NH Me
 N Me₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso - Pr
 CF₃
 O Me
 OC F₂ H
 S Me
 SO₂ Me
 NH Me
 N Me₂
 H
 Me
 NH₂
 CN
 iso - Pr
 CF₃
 O Me
 OC F₂ H
 S Me
 SO₂ Me
 NH Me
 N Me₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso - Pr
 CF₃
 O Me
 OC F₂ H
 S Me
 SO₂ Me
 NH Me
 N Me₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso - Pr
 CF₃
 O Me
 OC F₂ H
 S Me
 SO₂ Me
 NH Me
 N Me₂
 H
 Me
 NH₂
 Et
 iso - Pr

CN	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
CN	CH ₂ SO ₂ Me	OMe
CN	CH ₂ SO ₂ Me	OCF ₂ H
CN	CH ₂ SO ₂ Me	SM e
CN	CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ Me
CN	CH ₂ SO ₂ Me	NHMe
CN	CH ₂ SO ₂ Me	NMe ₂
CN	CH ₂ CN	H
CN	CH ₂ CN	Me
CN	CH ₂ CN	NH ₂
CN	CH ₂ CN	Et
CN	CH ₂ CN	iso-Pr
CN	CH ₂ CN	CF ₃
CN	CH ₂ CN	OMe
CN	CH ₂ CN	OCF ₂ H
CN	CH ₂ CN	SM e
CN	CH ₂ CN	SO ₂ Me
CN	CH ₂ CN	NHMe
CN	CH ₂ CN	NMe ₂

本発明化合物のあるものは畑地、非耕地用除草剤として、土壌処理、茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、イヌホウズキ (*Solanum nigrum*)、チョウセンアサガオ (*Datura stramonium*)等に代表されるナス科 (*Solanaceae*) 雑草、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、アメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*) 等に代表されるアオイ科 (*Malvaceae*) 雑草、マルバアサガオ (*Ipomoea purpurea*) 等のアサガオ類 (*Ipomoea* spps.)やヒルガオ類 (*Calystegia* spps.) 等に代表されるヒルガオ科 (*Convolvulaceae*) 雑草、イヌビユ (*Amaranthus lividus*)、アオビユ (*Amaranthus retroflexus*) 等に代表されるヒユ科 (*Amaranthaceae*) 雑草、オナモミ (*Xanthium pensylvanicum*)、ブタクサ (*Ambrosia artemisiaefolia*)、ヒマワリ (*Helianthus annuus*)、ハキダメギク (*Galinsoga ciliata*)、セイヨウトゲアザミ (*Cirsium arvense*)、ノボロギク (*Senecio vulgaris*)、ヒメジョオン (*Erigeron annuus*) 等に代表されるキク科 (*Compositae*) 雑草、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、ノハラガラシ (*Sinapis arvensis*)、ナズナ (*Capsella Bursapastoris*) 等に代表されるアブラナ科 (*Cruciferae*) 雑草、イヌタデ (*Polygonum Blumei*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*)等に代表されるタデ科 (*Polygonaceae*) 雑草、スベリヒユ (*Portulaca oleracea*) 等に代表されるスベリヒユ科 (*Portulacaceae*) 雑草、シロザ (*Chenopodium album*)、コアカザ (*Chenopodium ficifolium*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*)等に代表されるアカザ科 (*Chenopodia*

ceae) 雑草、ハコベ (*Stellaria media*) 等に代表されるナデシコ科 (*Caryophyllaceae*) 雑草、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、ツユクサ (*Commelina communis*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ホトケノザ (*Lamium amplexicaule*)、ヒメオドリコソウ (*Lamium purpureum*) 等に代表されるシソ科 (*Labiatae*) 雑草、コニシキソウ (*Euphorbia supina*)、オオニシキソウ (*Euphorbia maculata*) 等に代表されるトウダイグサ科 (*Euphorbiaceae*) 雑草、ヤエムグラ (*Galium spurium*)、アカネ (*Rubia akane*) 等に代表されるアカネ科 (*Rubiaceae*) 雑草、スミレ (*Viola mandshurica*) 等に代表されるスミレ科 (*Violaceae*) 雑草、アメリカツノクサネム (*Sesbania exaltata*)、エビスグサ (*Cassia obtusifolia*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草等の広葉雑草 (Broad-leaved weeds)、野生ソルガム (*Sorghum bicolor*)、オオクサキビ (*Panicum dichotomiflorum*)、ジョンソングラス (*Sorghum halepense*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*)、ヒメイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *praticola*)、栽培ビエ (*Echinochloa utilis*)、メヒシバ (*Digitaria adscendens*)、カラスムギ (*Avena fatua*)、オヒシバ (*Eleusine indica*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、スズメノテッポウ (*Alopecurus aequalis*) 等に代表されるイネ科雑草 (*Graminaceous weeds*)、ハマスゲ (*Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (*Cyperaceous weeds*) 等の各種畑地雑草 (Cropland weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

又、水田用除草剤として湛水下の土壌処理及び茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ヘラオモダカ (*Alisma canaliculatum*)、オモダカ (*Sagittaria trifolia*)、ウリカワ (*Sagittaria pygmaea*) 等に代表されるオモダカ科 (*Alismataceae*) 雑草、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*)、ミズガヤツリ (*Cyperus serotinus*)、ホタルイ (*Scirpus juncoides*)、クログワイ (*Eleocharis kuroguwai*) 等に代表されるカヤツリグサ科 (*Cyperaceae*) 雑草、アゼナ (*Lindernia pyxidaria*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、コナギ (*Monochoria vaginalis*) 等に代表されるミズアオイ科 (*Potamogetonaceae*) 雑草、ヒルムシロ (*Potamogeton distinctus*) 等に代表されるヒルムシロ科 (*Potamogetonaceae*) 雑草。

ceae) 雑草、キカシグサ (*Rotala indica*)等に代表されるミソハギ科 (Lythraceae) 雑草、タイヌビエ (*Echinochloa oryzicola*)、ヒメタイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *formosensis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*) 雑草等、各種、水田雑草 (Paddy weeds)に低薬量で高い殺草力を有する。

さらに本発明化合物のあるものは、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ビート等に対して高い安全性を有する。

本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤または共力剤などと混合施用しても良い。

特に、他の除草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能である。

本発明化合物と混合使用するのに好ましい除草剤としては、例えば、ピラズスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl/一般名)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl/一般名)、シノスルフロン (cinosulfuron/一般名)、イマズスルフロン (imazosulfuron/一般名)、アジムスルフロン (azimsulfuron/一般名)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl/一般名)、プレチラクロール (pretilachlor/一般名)、エスプロカルブ (esprocarb/一般名)、ピラゾレート (pyrazolate/一般名)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen/一般名)、ベンゾフェナップ (benzofenap/一般名)、ダイムロン (daimuron/一般名)、ブロモブチド (bromobutide/一般名)、ナプロアニリド (naproanilide/一般名)、クロメプロップ (clomeprop/一般名)、CNP (一般名)、クロメトキシニル (chlomethoxynil/一般名)、ビフェノックス (bifenox/一般名)、オキサジアゾン (oxadiazon/一般名)、オキサジアルギル (一般名)、カフェンストロール (cafenstrole/一般名)、オキサジクロメホン (oxaziclomef one/一般名)、インダノファン (indanofan/一般名)、ペントキサゾン (pent oxazone/一般名)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl/一般名)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl/一般名)、フェントラザミド (fentraz

amide／一般名)、メフェナセット (mefenacet／一般名)、ブタクロール (butachlor／一般名)、ブテナクロール (butenachlor／一般名)、ジチオピル (dithiopyl／一般名)、ベンフレセート (benfuresate／一般名)、ピリブチカルブ (pyributicarb／一般名)、ベンチオカーブ (benthiocarb／一般名)、ジメピペレート (dimepiperate／一般名)、モリネート (molinate／一般名)、ブタミフォス (butamifos／一般名)、キンクロラック (quinclorac／一般名)、シンメスリン (cinmethylin／一般名)、シメトリン (simetryn／一般名)、ベンスリド (bensulide／一般名)、ジメタメトリン (dimethametryn／一般名)、MCPA、MCPB、エトベンズアニド (etobenzanid)、クミルロン (cumyluron／一般名)、テニルクロール (thenylchlor／一般名)、エトキシスルフロノ (ethoxysulfuron／一般名)、キノクラミン (quinoclamine／一般名)、ベンゾビスシクロン (benzobicyclon／一般名)、ピリフタリド (pyriftalid／一般名)、ビスピリバック (bispyribac)、HSA-961 (試験名)、アニロホス (anilofos／一般名) 及びOK-701 (試験名) 等があげられる。

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体または液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤及び分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスポエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤及びゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することが出来る。また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することも出来る。なお必要に応じて、製剤または散布時に複数の他の除草剤、殺虫剤、殺菌剤、植物生長調整剤、肥料等と混合使用することも可能である。

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト及び珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム及び塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコール及びイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼン及びアルキルナ

フタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、 γ -ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油及びヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体及び液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリカルボン酸塩及びポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩及びアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型及びペタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔水和剤〕

本発明化合物	0.1～80部
固体担体	5～98.9部
界面活性剤	1～10部
その他	0～5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

〔乳 剤〕

本発明化合物	0. 1 ～ 3 0 部
液体担体	4 5 ～ 9 5 部
界面活性剤	4. 9 ～ 1 5 部
その他	0 ～ 1 0 部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔懸濁剤〕

本発明化合物	0. 1 ～ 7 0 部
液体担体	1 5 ～ 9 8. 8 9 部
界面活性剤	1 ～ 1 2 部
その他	0. 0 1 ～ 3 0 部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

〔顆粒水和剤〕

本発明化合物	0. 1 ～ 9 0 部
固体担体	0 ～ 9 8. 9 部
界面活性剤	1 ～ 2 0 部
その他	0 ～ 1 0 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

本発明化合物	0. 0 1 ～ 7 0 部
液体担体	2 0 ～ 9 9. 9 9 部
その他	0 ～ 1 0 部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

〔粒 剤〕

本発明化合物	0. 0 1 ～ 8 0 部
固体担体	1 0 ～ 9 9. 9 9 部
その他	0 ～ 1 0 部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

本発明化合物	0.01～30部
固体担体	65～99.99部
その他	0～5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤を水で1～10000倍に希釈してまたは希釈せずに、有効成分が1ヘクタール（ha）当たり0.001～50kg、好ましくは0.01～10kgになるように散布する。

製剤例

次に具体的に本発明化合物を有効成分とする農薬製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物No. 1	20部
パイロフィライト	76部
ソルポール5039	2部

（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

カープレックス#80D	2部
-------------	----

（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

〔配合例2〕乳 剤

本発明化合物No. 1	5部
キシレン	75部
N-メチルピロリドン	15部
ソルポール2680	5部

（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

以上を均一に混合して乳剤とする。

〔配合例 3〕懸濁剤（フロアブル剤）

本発明化合物 No. 1	25 部
アグリゾール S-710	10 部
（非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名）	
ルノックス 1000C	0.5 部
（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）	
キサントガム	0.2 部
水	64.3 部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

〔配合例 4〕顆粒水和剤（ドライフロアブル剤）

本発明化合物 No. 1	75 部
ハイテノール NE-15	5 部
（アニオン性界面活性剤：第一工業製薬（株）商品名）	
バニレックス N	10 部
（アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名）	
カープレックス #80D	10 部
（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）	

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

〔配合例 5〕粒 剤

本発明化合物 No. 1	5 部
ベントナイト	50 部
タルク	45 部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

〔配合例 6〕粉 剤

本発明化合物 No. 1	3 部
カープレックス #80D	0.5 部
（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）	

カオリナイト 9 5 部

リン酸ジイソプロピル 1 . 5 部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

〔試験例 1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

33.3 c m²のスチロールカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し水深 4 cm の湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ、コナギのそれぞれの種子を上記のポットに混播した後、2 . 5 葉期のイネ苗を移植した。ポットを 2 5 ~ 3 0 ℃ の温室内に置いて植物を育成し、播種後 1 日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例 1 に準じて調整した本発明化合物の水和剤を水で希釈して処理した。処理後 3 週間目に、イネ及び各種雑草に対する除草効果の調査を行った。0 は影響なし、5 は完全枯死を示す 5 段階評価である。結果を第 7 表に示す。

〔試験例 2〕湛水条件における雑草生育期処理による除草効果試験

33.3 c m²のスチロールカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し水深 4 cm の湛水条件とした。ノビエの種子を上記のポットに混播した。ポットを 2 5 ~ 3 0 ℃ の温室内に置いて植物を育成し、ノビエ、ホタルイ、コナギが 1 ~ 2 葉期に達したとき、水面へ所定の薬量になるように、配合例 1 に準じて調整した本発明化合物の水和剤を水で希釈して処理した。処理後 3 週間目に、各種雑草に対する除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査を行った。結果を第 8 表に示す。

〔試験例 3〕土壌処理による除草効果試験

縦 2 1 cm、横 1 3 cm、深さ 7 cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1 . 5 cm 覆土した後、有効成分量が所定の割合となるように土壌表面へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例 1 に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用い、これを全面に散布した。薬液散布 3 週間後に植物に対す

る除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査を行った。結果を第 9 表に示す。

〔試験例 4〕茎葉処理による除草効果試験

縦 21 cm、横 13 cm、深さ 7 cm のプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子をそれぞれスポット状に播種し、約 1.5 cm 覆土した後、25～30℃の温室において植物を 14 日間育成し、有効成分量が所定の割合となるように茎葉部へ小型スプレーで均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例 1 に準じて適宜調整された水和剤を水で希釈して用い、これを全面に散布した。薬液散布 3 週間後に植物に対する除草効果を試験例 1 の判定基準に従って調査を行った。結果を第 10 表に示す。

なお、各表中の記号は次の意味を示す。

A (ノビエ)、B (ホタルイ)、C (コナギ)、D (メヒシバ)、E (エノコログサ)、F (カラスムギ)、G (ブラックグラス)、H (イチビ)、I (ブタクサ)、J (アオゲイトウ)、K (シロザ)、L (イヌタデ)、M (オオイヌノフグリ)、N (ハコベ)、a (移植イネ)、b (トウモロコシ)、c (ダイズ)、d (ワタ)、e (コムギ)、f (ビート)

〔第 7 表〕

化合物 No.	処理薬量 g/a	A	B	C	a
------------	-------------	---	---	---	---

1	10	1	1	2	0
2	10	5	5	5	2
3	2.52	5	5	5	2
4	2.52	5	5	5	4
5	10	3	1	4	1
6	10	4	5	5	1

7	2.52	5	5	5	5
12	2.52	5	5	5	5
14	10	2	2	1	0
15	10	3	4	5	1
16	10	4	4	5	0
18	10	2	2	5	0
19	10	5	4	5	1
22	20	5	5	5	2
23	10	0	2	2	0
24	2.52	5	5	5	4
25	10	2	2	1	0
26	10	3	1	5	1
27	10	2	2	2	0
29	2.52	5	5	5	2
30	2.52	5	4	5	2
31	2.52	4	3	5	1
32	2.52	5	5	5	2
33	2.52	4	5	5	2
35	2.2	4	4	5	2
36	10	2	5	4	0
37	10	4	5	5	1
38	20	5	5	5	-
39	2.52	5	5	5	2
40	2.52	5	5	5	4
41	2.52	5	5	5	5
42	2.52	5	5	5	4
43	2.52	5	5	5	4
44	2.52	5	5	5	4
45	2.52	5	5	5	1

46	2.52	5	5	5	5
47	2.52	3	0	5	1
49	2.52	5	5	5	2
51	2.52	5	5	5	4
52	2.52	5	5	5	3
53	2.52	5	4	5	3
54	2.52	5	5	5	1
55	2.52	5	5	5	5
56	2.52	5	5	5	3
57	2.52	5	5	5	3
58	2.52	5	5	5	3
59	2.52	5	5	5	3
60	2.52	4	3	5	0
61	2.52	5	5	5	5
62	2.52	5	4	5	2
63	2.52	5	5	5	1
65	2.52	4	-	5	5
66	2.52	5	5	5	3
67	2.52	4	5	5	3
68	2.52	5	-	5	2
69	2.52	5	-	5	4
70	2.52	5	-	5	4
71	2.52	5	5	5	3
72	2.52	5	5	5	2
74	2.52	5	-	5	4
75	2.52	0	-	5	1
76	2.52	5	5	5	2
77	2.52	5	5	5	3
78	2.52	5	5	5	5

79	2.52	5	5	5	4
80	2.52	5	4	5	2
81	2.52	4	2	5	1
82	2.52	2	2	5	0
83	2.52	4	2	5	2
84	2.52	3	4	5	2
85	2.52	5	5	5	3
86	2.52	5	5	5	4
87	2.52	5	3	5	2
88	2.52	4	3	5	4
89	2.52	4	3	5	3
90	2.52	4	1	5	4
91	2.52	5	5	5	4
92	2.52	5	5	5	4
93	2.52	5	5	5	5
94	2.52	5	5	5	5
95	2.52	5	4	5	4
96	2.52	5	5	5	5
97	2.52	5	4	5	5
98	2.52	5	4	5	5
99	2.52	5	5	5	3
100	2.52	5	5	5	5
101	2.52	5	5	5	4
102	2.52	5	4	5	2
103	2.52	5	5	5	3
104	2.52	5	5	5	5
105	2.52	5	5	5	2
106	2.52	5	4	5	3
107	2.52	3	2	5	1

108	2.52	2	2	5	1
109	2.52	4	2	5	1
110	2.52	4	3	5	2
111	2.52	0	1	5	1
112	2.52	2	1	5	2
113	2.52	2	2	5	2
114	2.52	4	3	5	3
115	2.52	5	3	5	2
116	2.52	5	4	5	3
117	2.52	0	1	5	1
118	2.52	5	5	5	3
119	2.52	5	4	5	2
120	2.52	5	5	5	5
121	2.52	5	5	5	2
122	2.52	5	4	5	4
123	2.52	5	4	5	5
124	2.52	5	4	5	5
125	0.64	5	5	5	2
126	0.64	0	0	2	0
127	0.64	5	4	5	3
128	0.64	5	4	5	2
129	0.64	4	3	5	1
130	0.64	2	1	5	1
131	0.64	0	0	3	1
132	0.64	5	4	5	2
133	0.64	4	3	5	1
134	0.64	5	2	5	1
135	0.64	5	3	5	2
136	0.64	5	3	5	2

137	0.64	5	4	5	2
138	0.64	3	1	5	0
139	0.64	5	4	5	3
140	0.64	4	5	5	3
141	0.64	5	4	5	2
142	0.64	3	2	5	1
143	0.64	5	5	5	2
144	0.64	3	1	5	1
145	0.64	2	0	5	1
146	0.64	5	1	5	2
147	0.64	2	0	5	1
148	0.64	0	0	5	0
149	0.64	5	2	5	2
150	0.64	5	2	5	1
151	0.64	5	2	5	1
152	0.64	5	3	5	1
153	0.64	5	3	5	2
154	0.64	4	1	5	1
155	0.64	5	3	5	1
156	0.64	5	1	5	1
157	0.64	5	2	5	2
159	0.64	4	3	5	2
160	0.64	3	2	5	2
161	0.64	0	0	5	0
162	0.64	1	1	5	0
163	0.64	4	2	5	1
164	0.64	4	2	5	1
165	0.64	5	5	5	1
166	0.64	5	5	5	1

167	0.64	5	2	5	1
168	0.64	5	3	5	0
169	0.64	5	3	5	1
170	0.64	5	3	5	1
171	0.64	5	5	5	1
172	0.64	5	3	5	0
173	0.64	5	3	5	1
174	0.64	5	3	5	1
175	0.64	5	3	5	1
176	0.64	4	2	5	0
177	0.64	4	2	5	1
178	0.64	3	2	5	0
179	0.64	4	2	5	0
180	0.64	4	2	5	1
181	0.64	3	2	5	1
182	0.64	0	1	5	1
183	0.64	5	2	5	1
184	0.64	4	3	5	2
185	0.64	3	1	5	1
186	0.64	2	1	5	1
187	0.64	3	2	5	2
188	0.64	0	0	5	1
189	0.64	2	1	5	1
190	0.64	2	2	5	1
191	0.64	0	0	5	0
192	0.64	0	0	5	0
193	0.64	0	0	5	1
194	0.64	2	1	5	1
195	0.64	2	2	5	0

196	0.64	5	5	5	2
197	0.64	5	4	5	3
198	0.64	5	5	5	2
199	0.64	5	5	5	2
200	0.64	5	5	5	2
201	0.64	1	0	1	0
230	0.64	2	1	5	0
202	2.52	4	2	5	1
203	2.52	5	3	5	2
204	2.52	5	5	5	2
205	2.52	4	2	5	1
206	2.52	5	5	5	3

〔第 8 表〕

化合物	处理薬量	A	B	C
No.	g/a			

1	10	2	1	2
2	10	5	4	4
3	2.52	5	5	5
4	2.52	5	5	5
5	10	2	1	2
6	10	2	2	2
7	2.52	5	5	5
12	2.52	5	5	5
14	10	1	2	1
15	10	3	3	3
16	10	4	3	3

18	10	2	2	3
19	10	5	2	3
22	20	5	3	3
23	10	0	0	1
24	2.52	5	4	5
25	10	1	1	0
26	10	1	1	0
27	10	2	2	1
29	2.52	3	2	3
30	2.52	4	3	4
31	2.52	0	1	3
32	2.52	5	4	4
33	2.52	4	3	4
35	2.2	5	4	4
36	10	1	1	2
37	10	2	2	3
38	20	5	5	5
39	2.52	4	4	5
40	2.52	5	4	5
41	2.52	5	5	5
42	2.52	5	5	5
43	2.52	5	5	5
44	2.52	5	4	5
45	2.52	5	4	5
46	2.52	5	5	5
47	2.52	5	3	3
49	2.52	5	4	4
51	2.52	5	4	4
52	2.52	5	4	5

53	2.52	5	5	5
54	2.52	4	2	3
55	2.52	5	5	5
56	2.52	5	5	5
57	2.52	5	4	5
58	2.52	5	5	5
59	2.52	5	4	5
60	2.52	1	0	0
61	2.52	5	5	5
62	2.52	5	3	4
63	2.52	5	3	3
65	2.52	4	5	5
66	2.52	4	-	5
67	2.52	5	-	5
68	2.52	3	4	5
69	2.52	5	4	5
70	2.52	5	-	5
71	2.52	4	4	5
72	2.52	5	2	5
74	2.52	3	2	4
75	2.52	1	1	3
76	2.52	4	2	3
77	2.52	4	2	3
78	2.52	5	3	5
79	2.52	5	3	5
80	2.52	3	1	3
82	2.52	0	2	5
83	2.52	3	1	5
84	2.52	2	1	5

85	2.52	5	2	4
86	2.52	5	2	4
87	2.52	2	1	2
88	2.52	2	0	3
89	2.52	2	1	3
90	2.52	1	0	1
91	2.52	5	3	3
92	2.52	5	2	4
93	2.52	5	4	4
94	2.52	5	4	5
95	2.52	4	1	2
96	2.52	5	3	4
97	2.52	3	1	1
98	2.52	4	2	3
99	2.52	4	2	2
100	2.52	5	2	4
101	2.52	5	2	3
102	2.52	3	2	3
103	2.52	5	3	4
104	2.52	5	3	4
105	2.52	5	2	4
106	2.52	5	2	3
107	2.52	2	1	5
108	2.52	2	2	5
109	2.52	1	1	5
110	2.52	2	2	5
111	2.52	1	0	4
112	2.52	2	1	3
113	2.52	2	0	3

114	2.52	5	2	2
115	2.52	4	1	2
116	2.52	5	2	3
117	2.52	0	1	4
118	2.52	5	2	2
119	2.52	2	2	2
120	2.52	5	2	4
121	2.52	4	2	4
122	2.52	5	1	2
123	2.52	4	2	3
124	2.52	5	2	2
125	0.64	4	2	2
127	0.64	3	2	3
128	0.64	5	2	2
130	0.64	0	0	5
132	0.64	1	1	1
133	0.64	3	0	2
134	0.64	1	0	0
135	0.64	4	1	2
136	0.64	1	1	2
137	0.64	5	2	2
138	0.64	2	1	2
139	0.64	4	2	5
140	0.64	5	2	3
141	0.64	3	1	3
142	0.64	2	1	0
143	0.64	4	2	2
144	0.64	1	0	1
145	0.64	0	0	2

WO 01/68613

PCT/JP01/02158

146	0.64	4	1	2
148	0.64	0	0	2
149	0.64	5	1	1
150	0.64	4	0	1
151	0.64	1	0	0
152	0.64	2	1	0
154	0.64	4	1	2
156	0.64	5	2	2
157	0.64	4	2	2
159	0.64	1	0	2
160	0.64	0	0	2
164	0.64	1	0	2
165	0.64	1	0	2
166	0.64	2	0	1
167	0.64	1	0	3
168	0.64	1	0	0
169	0.64	3	1	1
170	0.64	3	1	2
171	0.64	0	0	2
172	0.64	0	0	1
173	0.64	0	0	1
174	0.64	0	0	2
175	0.64	0	0	1
178	0.64	0	0	2
179	0.64	0	0	1
182	0.64	0	0	1
183	0.64	2	0	1
184	0.64	3	1	4
185	0.64	1	1	4

186	0.64	0	1	5
187	0.64	0	2	5
188	0.64	1	0	4
189	0.64	0	1	3
190	0.64	1	1	5
191	0.64	0	0	5
192	0.64	0	1	3
193	0.64	0	0	5
194	0.64	1	0	4
195	0.64	2	0	2
196	0.64	4	2	5
197	0.64	5	2	5
198	0.64	5	2	4
199	0.64	5	1	5
200	0.64	0	0	3
202	2.52			
203	2.52			
204	2.52			
205	2.52			
206	2.52			
202	2.52	0	1	1
203	2.52	1	2	2
204	2.52	5	3	5
205	2.52	2	0	0
206	2.52	5	3	5

〔第9表〕

化合物 藥量

No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
1	6.3	3	2	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0
2	6.3	5	5	3	4	1	4	5	5	5	5	0	1	0	-	4	0
3	6.3	5	5	4	4	5	3	5	5	5	5	1	3	1	2	4	5
4	6.3	5	5	3	3	5	5	5	5	5	5	5	4	1	5	3	5
6	6.3	0	0	1	2	0	0	1	0	0	5	0	0	0	0	0	1
7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	1	5	5
12	6.3	5	4	5	5	3	2	5	5	5	5	5	3	1	2	3	5
15	25	4	4	0	0	4	4	4	5	4	0	0	1	0	-	0	5
16	25	5	4	0	0	3	-	5	5	5	5	3	0	0	-	0	5
17	25	4	2	0	0	0	0	4	5	5	4	1	0	0	-	0	0
18	25	3	3	0	0	0	0	-	-	-	1	1	0	-	0	0	1
19	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	4	1	-	4	5
20	25	-	3	0	0	2	-	-	-	-	0	3	3	1	-	0	0
22	50	5	5	4	5	5	2	5	5	5	5	0	5	2	-	4	5
24	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	-	2	3	-	-	4	5
25	25	1	1	0	0	2	-	4	-	5	5	1	0	0	-	0	1
26	25	5	3	1	0	5	1	5	5	5	5	3	1	2	-	0	4
27	25	5	3	0	0	5	-	5	5	5	5	2	1	2	-	0	3
28	25	0	0	0	2	1	-	4	-	4	0	1	1	0	-	0	0
29	6.3	5	5	4	4	1	3	5	-	5	5	1	0	0	-	3	4
30	6.3	5	5	5	5	4	5	5	-	5	5	4	1	0	-	4	5
31	6.3	2	1	0	2	1	3	5	-	3	5	0	0	0	-	1	5
32	6.3	4	5	4	4	5	4	5	-	5	5	5	4	2	-	5	5
33	6.3	4	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	5	1	-	4	5
35	5.5	4	5	3	4	5	4	5	-	5	5	5	4	2	4	0	5
36	25	4	3	1	0	5	0	4	-	4	5	0	0	0	0	2	5
37	25	5	4	1	3	5	5	5	-	5	5	0	0	2	0	2	5

39	6.3	3	4	0	3	5	5	5	-	5	5	5	3	1	4	0	5
40	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	-	5	5
41	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	2	-	5	5
42	6.3	5	5	5	5	5	4	5	-	5	5	5	5	3	-	5	5
43	6.3	5	5	4	4	5	5	5	-	5	5	3	3	1	-	3	5
44	6.3	5	5	5	4	5	3	5	-	5	5	5	4	4	-	4	5
45	6.3	5	5	5	4	4	4	5	-	5	5	2	2	2	-	2	4
46	6.3	3	2	2	3	5	5	5	-	5	5	0	0	1	-	3	5
47	6.3	5	5	4	2	5	5	5	-	5	5	5	4	2	3	3	5
48	6.3	3	2	0	0	5	3	5	-	4	4	1	0	2	0	0	4
49	6.3	5	5	-	4	4	4	5	-	5	5	4	0	0	0	4	5
50	50	4	1	2	3	0	0	4	-	0	5	2	0	1	0	3	5
51	6.3	5	5	4	4	5	-	5	-	5	5	4	5	2	0	4	5
52	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	4	2	4	5
53	6.3	5	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	5	3	2	4	5
54	6.3	5	4	3	4	5	4	5	-	5	5	5	3	0	0	4	5
55	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	3	4	5
56	6.3	5	5	4	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	4	4	5
57	6.3	5	3	3	5	1	0	5	-	5	5	2	0	0	1	5	5
58	6.3	5	4	1	0	5	5	5	-	4	5	3	2	0	0	1	5
59	6.3	5	5	3	4	5	4	5	-	5	5	5	3	2	2	3	5
60	6.3	4	0	1	5	0	0	2	-	0	3	0	0	0	0	0	3
61	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	2	5	5	5
62	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	3	2	-	4	5
63	6.3	0	0	2	4	0	-	5	-	5	5	5	4	2	0	3	5
65	6.3	5	5	1	3	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	0	5
66	6.3	5	4	0	0	2	0	5	4	3	0	0	0	0	0	0	0
67	6.3	3	3	0	4	4	3	5	4	3	3	0	0	0	0	0	1
68	6.3	5	5	0	0	2	0	5	2	2	4	1	0	0	0	0	0

69	6.3	5	5	0	0	5	4	5	5	5	4	1	1	0	0	0	0
70	6.3	4	4	0	2	3	5	5	5	5	5	1	2	0	0	1	5
71	6.3	5	2	1	0	5	4	5	3	3	5	4	0	0	0	0	5
72	6.3	5	3	4	2	2	2	5	5	-	5	4	0	1	0	1	5
74	6.3	4	3	0	2	5	3	5	5	-	5	3	-	-	-	1	5
75	6.3	0	0	1	0	4	4	5	5	-	5	0	0	0	0	0	5
76	6.3	5	4	3	2	1	0	5	5	5	5	1	0	0	0	0	2
77	6.3	4	0	1	1	0	4	5	5	5	5	0	2	0	0	1	5
78	6.3	5	5	4	2	5	2	5	5	5	5	4	4	0	2	4	4
79	6.3	5	3	3	0	2	0	5	5	5	5	2	2	0	0	2	2
80	6.3	5	5	0	1	2	0	0	4	0	5	1	0	0	0	2	1
81	6.3	0	0	1	0	0	0	4	0	0	4	0	0	0	0	1	1
82	6.3	0	0	1	0	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5
83	6.3	5	4	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	3	5
84	6.3	1	2	0	4	5	5	5	5	5	5	4	1	0	2	1	5
85	6.3	5	-	4	4	3	0	5	5	5	5	3	2	0	1	4	5
86	6.3	5	-	4	5	2	0	5	5	5	5	3	0	0	0	4	5
87	6.3	3	-	3	4	0	0	5	4	5	5	0	0	0	0	1	2
88	6.3	3	-	1	3	2	0	5	5	4	2	1	0	0	0	2	3
89	6.3	3	-	3	1	0	0	5	5	2	4	0	0	0	0	1	1
90	6.3	3	-	1	2	0	0	5	5	5	3	1	0	0	0	1	5
91	6.3	5	-	1	2	3	4	5	5	5	5	4	2	0	0	0	5
92	6.3	5	-	4	4	3	0	5	5	5	5	3	0	0	1	2	5
93	6.3	5	-	5	3	5	4	5	5	5	5	5	0	0	1	3	5
94	6.3	5	-	5	5	5	3	5	5	5	5	5	3	2	2	3	5
95	6.3	4	-	1	1	0	0	5	4	0	5	0	0	0	0	0	5
96	6.3	5	-	5	5	5	3	5	5	5	5	4	4	2	0	5	5
97	6.3	5	-	3	3	0	0	5	0	4	5	1	0	0	0	1	1
98	6.3	5	-	3	1	2	2	5	4	5	5	2	0	0	0	1	5

99	6.3	5	-	4	3	5	1	5	5	5	5	5	0	0	0	1	5
100	6.3	5	-	5	4	5	4	5	5	5	5	5	2	2	1	3	5
101	6.3	5	-	3	2	5	5	5	5	5	5	5	4	0	2	3	5
102	1.6	5	-	3	2	2	0	5	5	5	5	3	3	0	0	4	5
103	6.3	5	-	4	5	5	3	5	5	5	5	4	3	2	0	3	5
104	6.3	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	1	0	5	5
105	6.3	5	-	3	5	5	4	5	5	5	5	3	3	0	0	4	4
106	6.3	5	-	5	5	5	2	5	5	5	5	2	4	0	0	5	4
107	6.3	2	-	1	1	5	5	5	5	5	5	4	2	0	0	1	5
108	6.3	5	-	3	3	5	5	5	5	5	5	3	0	0	0	3	0
109	6.3	5	-	4	3	5	5	5	5	5	5	1	0	0	0	1	5
110	6.3	5	-	4	3	5	5	5	5	5	5	2	1	0	0	1	5
111	6.3	0	-	1	2	5	5	5	5	3	5	5	0	0	0	1	5
112	6.3	0	-	1	1	5	5	5	5	5	5	4	0	0	1	1	5
113	6.3	5	-	4	4	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	4	5
114	6.3	5	-	3	4	5	5	5	5	5	5	5	3	0	0	2	5
115	6.3	5	-	2	1	5	0	5	5	5	5	5	1	0	0	1	5
116	6.3	5	-	4	5	5	5	5	5	5	5	5	2	0	0	4	5
117	6.3	0	-	2	0	5	5	5	5	5	5	5	0	0	0	1	5
118	6.3	5	-	3	4	5	5	5	5	5	5	5	2	0	0	2	5
119	6.3	5	-	1	3	5	0	5	4	0	5	2	0	0	0	3	5
120	6.3	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	2	5	5
121	6.3	5	-	4	4	4	4	5	4	5	5	3	1	0	0	4	2
122	6.3	5	-	3	3	5	4	5	5	5	5	3	3	2	0	4	5
123	6.3	5	-	4	2	5	4	5	5	5	5	3	4	1	0	3	5
124	6.3	5	-	4	5	5	4	5	5	5	5	5	4	3	0	4	5
125	1.6	5	-	3	2	3	0	5	5	5	5	3	2	0	0	3	5
126	1.6	0	-	1	1	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0
127	1.6	5	-	3	3	5	0	5	5	5	5	3	0	0	0	4	5

128	1.6	5	-	2	3	5	0	5	5	5	5	5	1	0	0	4	5
129	1.6	4	-	0	0	3	-	5	5	5	5	1	1	0	0	0	3
130	1.6	0	-	0	1	5	4	5	5	4	5	2	0	0	0	0	5
131	1.6	4	-	1	1	0	0	4	5	5	5	0	0	0	0	1	5
132	1.6	5	-	0	0	0	2	5	4	4	5	2	0	0	0	2	4
133	1.6	5	-	1	2	4	0	5	5	5	5	5	2	0	0	2	5
134	1.6	4	-	1	1	4	0	5	2	0	5	0	2	0	0	1	3
135	1.6	5	-	3	1	5	3	5	5	5	5	5	2	0	0	4	5
136	1.6	5	-	2	1	3	0	5	5	5	5	3	0	0	0	2	4
137	1.6	5	-	3	3	5	4	5	5	5	5	4	3	0	0	4	5
138	1.6	5	-	4	3	5	0	5	5	5	5	3	1	0	0	3	5
139	1.6	5	-	4	3	5	4	5	5	5	5	3	3	0	0	3	5
140	1.6	5	-	3	3	5	4	5	5	5	5	4	3	0	0	4	5
141	1.6	5	-	2	1	4	0	5	5	5	5	0	0	0	0	1	3
142	1.6	4	-	2	0	3	0	5	5	5	5	2	0	0	0	1	5
143	1.6	5	-	3	3	3	0	5	5	5	5	4	4	0	0	3	4
144	1.6	2	-	1	1	0	0	5	5	0	3	0	0	0	0	1	4
145	1.6	3	-	2	1	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5
146	1.6	5	-	4	3	5	0	5	5	5	5	5	2	0	0	4	5
147	1.6	0	-	3	2	0	0	5	4	0	1	0	0	0	0	2	1
148	1.6	0	-	3	2	0	0	5	4	4	3	0	0	0	0	2	1
149	1.6	5	-	4	3	5	2	5	5	5	5	5	2	0	0	3	5
150	1.6	5	-	3	2	5	0	5	5	5	5	4	4	0	0	2	5
151	1.6	5	-	1	1	5	0	5	5	5	5	2	2	0	0	2	5
152	1.6	5	-	2	2	5	3	5	5	5	5	1	2	0	0	1	5
153	1.6	5	-	1	2	5	2	5	5	5	5	0	2	0	0	1	5
154	1.6	5	-	2	1	4	5	5	5	5	5	4	3	0	0	3	5
155	1.6	5	-	0	1	0	0	5	5	5	5	0	0	0	0	1	5
156	1.6	5	-	3	3	5	0	5	5	5	5	4	2	0	0	2	5

157	1.6	5	-	3	2	5	3	5	5	5	5	3	4	2	0	3	5
158	1.6	0	-	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0
159	1.6	0	-	0	1	3	4	5	4	4	5	2	0	0	0	1	4
160	1.6	4	-	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5
161	1.6	4	-	0	0	5	5	5	5	5	5	2	1	0	0	1	5
162	1.6	4	-	0	0	5	4	5	5	5	5	3	2	0	0	1	5
163	1.6	2	-	0	2	3	0	5	4	4	5	0	0	0	0	1	5
164	1.6	0	0	1	0	2	0	5	4	0	5	0	0	0	0	0	4
165	1.6	0	0	1	0	2	0	3	4	0	5	0	0	0	0	0	3
166	1.6	4	3	0	0	2	0	4	5	5	5	0	0	0	0	0	3
167	1.6	5	2	1	1	1	0	3	4	4	5	0	0	0	0	0	4
168	1.6	4	2	1	1	0	0	4	5	5	3	0	0	0	0	1	4
169	1.6	4	4	1	2	5	0	5	4	5	5	0	0	0	0	1	3
170	1.6	4	4	1	1	3	0	5	5	5	5	0	1	0	0	1	5
171	1.6	5	3	1	1	1	0	5	5	5	4	0	2	0	0	2	3
172	1.6	3	3	1	1	3	0	5	5	4	4	0	0	0	0	0	2
173	1.6	5	3	1	0	0	0	5	4	5	4	0	0	0	0	1	2
174	1.6	3	2	1	0	0	0	5	5	0	3	0	0	0	0	1	3
175	1.6	-	2	0	0	0	0	4	5	3	2	0	0	0	0	0	3
176	1.6	0	0	1	0	0	0	4	4	0	0	0	0	0	0	0	1
177	1.6	4	2	0	0	0	0	4	4	4	5	0	0	-	0	1	2
178	1.6	0	0	0	0	0	0	3	3	0	0	0	0	0	0	0	0
179	1.6	0	0	0	2	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	3
180	1.6	0	0	1	0	0	0	0	2	0	3	0	0	0	0	0	1
181	1.6	2	0	3	0	0	0	3	3	0	2	0	0	0	0	1	3
182	1.6	0	0	0	0	0	0	0	-	0	4	0	0	0	0	0	0
183	1.6	5	4	1	1	4	0	4	5	5	5	3	0	0	0	1	5
184	1.6	5	4	-	1	5	0	5	5	5	5	2	0	0	0	1	5
185	1.6	0	0	0	0	5	4	5	5	3	5	0	2	0	0	0	4

186	1.6	0	0	0	0	2	0	5	5	0	5	0	0	0	0	0	5
187	1.6	3	0	-	1	5	4	5	5	2	5	0	0	0	0	1	5
188	1.6	0	0	1	0	5	3	5	5	0	2	0	0	0	0	0	5
189	1.6	0	0	0	0	2	3	0	4	0	5	0	0	0	0	1	5
190	1.6	0	0	0	1	5	2	4	5	3	5	0	0	0	0	1	1
191	1.6	0	0	1	0	0	0	3	5	0	5	0	0	0	0	0	4
192	1.6	0	0	0	0	0	0	0	4	0	5	0	0	0	0	0	4
193	1.6	0	0	0	1	2	4	5	5	3	5	0	0	0	0	0	5
194	1.6	3	4	0	0	0	0	3	4	3	0	0	0	0	0	0	0
195	1.6	4	4	1	0	0	0	5	5	0	5	0	0	0	0	0	0
196	1.6	5	4	4	3	2	0	5	5	5	5	0	0	0	0	1	3
197	1.6	5	5	4	3	3	0	5	5	5	5	3	1	0	0	1	4
198	1.6	5	5	1	1	2	3	5	5	5	5	3	0	0	0	0	2
199	1.6	5	4	1	1	2	0	5	5	5	5	2	0	0	0	0	3
200	1.6	5	4	4	1	5	0	5	5	5	5	3	0	0	0	1	5
230	1.6	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	1
202	6.3	0	0	0	0	3	3	5	5	0	5	0	0	0	0	0	3
203	6.3	4	0	2	3	4	5	5	5	5	5	1	0	0	0	2	5
204	6.3	5	5	4	4	4	3	5	5	5	4	0	2	0	0	3	5
205	6.3	5	3	1	2	2	0	4	5	5	5	0	1	0	0	1	5
206	6.3	4	5	4	3	5	4	5	5	5	5	0	0	0	0	3	5

[第 10 表]

化合物 藥量

No.	g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
<hr/>																	
1	6.3	3	-	1	0	3	0	4	2	0	3	0	1	1	1	0	1
2	6.3	5	5	4	5	5	3	5	5	5	5	4	4	4	4	4	-

3	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	2	5
4	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	2	5
6	6.3	1	1	1	1	5	1	5	4	5	5	4	2	3	-	-	5
7	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
12	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
13	6.3	1	1	0	1	4	1	3	4	5	2	1	1	2	1	0	4
14	6.3	1	1	0	0	2	0	2	2	2	3	0	1	2	0	0	1
15	25	4	4	1	1	5	-	5	5	4	5	0	2	4	4	1	5
16	25	5	4	2	2	5	3	5	5	5	5	1	2	4	5	1	5
17	25	1	1	1	1	4	3	5	5	5	5	2	0	2	4	2	1
18	25	2	1	1	1	2	1	5	-	5	4	5	1	2	2	1	3
19	25	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	3	5	4	4	5	5
22	50	5	4	5	5	5	2	5	5	5	-	0	5	4	-	5	5
23	6.3	0	0	2	0	-	-	-	-	-	2	1	0	1	-	0	2
24	6.3	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	3	4	-	4	5
25	25	2	2	2	1	4	1	5	4	5	-	2	0	2	-	1	2
26	25	4	3	2	1	5	-	5	5	5	-	1	3	2	-	0	5
27	25	4	3	0	0	3	2	4	3	4	5	0	2	2	-	0	4
28	25	2	2	2	1	3	4	4	4	4	2	2	1	2	-	1	0
29	6.3	4	4	4	5	5	5	5	-	5	5	4	2	2	-	5	5
30	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	4	5	4	-	5	5
31	6.3	2	1	2	2	3	5	5	-	5	5	5	1	3	-	2	5
32	6.3	4	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	4	-	4	5
33	6.3	4	5	4	4	5	5	5	-	5	5	5	4	3	-	4	5
35	5.5	3	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	4	3	5	5	5
36	25	2	2	1	2	4	4	4	-	4	5	2	1	3	2	2	2
37	25	5	4	0	5	5	5	5	-	5	5	1	2	4	3	2	5
39	6.3	4	4	4	3	5	5	5	-	5	5	5	5	4	5	3	5
40	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	-	5	5

41	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	-	5	5
42	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	-	5	5
43	6.3	5	5	5	4	5	5	5	-	5	5	5	5	5	-	4	5
44	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	4	5	5	-	5	5
45	6.3	5	5	5	4	5	5	5	-	5	4	4	4	3	-	3	5
46	6.3	5	5	4	3	5	5	5	-	5	5	5	4	3	-	4	5
47	6.3	5	5	3	2	5	5	5	-	5	5	5	4	5	5	3	5
48	6.3	1	1	5	2	5	1	5	-	5	5	3	2	2	4	2	5
49	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5
50	50	3	1	1	3	0	0	5	-	2	5	2	0	0	2	1	4
51	6.3	5	5	5	5	5	4	5	-	5	5	4	5	4	5	4	5
52	6.3	5	5	4	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	4	5
53	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	4	5	5	5
54	6.3	4	4	5	3	5	5	5	-	5	5	5	3	4	5	3	5
55	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5
56	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	5	5
57	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	3	0	5	5	4	5
58	6.3	5	5	5	3	5	5	5	-	5	5	4	5	5	5	-	5
59	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	-	-	5	5	5	5	-
60	6.3	3	1	4	2	2	0	2	-	2	4	3	2	1	3	3	4
61	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
62	6.3	5	5	5	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	-	5	5
63	6.3	5	5	4	4	5	2	5	-	5	5	5	4	4	5	3	5
64	25	2	2	1	2	2	1	5	5	5	-	0	2	1	1	0	2
65	6.3	5	5	4	2	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
66	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	4	2	3	4	5	4	5
67	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	3	4	5	3	5
68	6.3	5	4	4	3	4	3	5	5	5	4	3	3	3	4	3	5
69	6.3	5	5	4	3	5	5	5	5	5	4	3	4	5	5	3	5

70	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	4	5
71	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	4	5
72	6.3	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	4	5
74	6.3	5	5	5	2	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5	3	5
75	6.3	4	5	4	2	5	5	5	5	5	5	3	2	3	5	3	5
76	6.3	5	5	4	4	5	4	5	5	5	5	4	4	3	4	3	5
77	6.3	5	5	4	3	5	4	5	5	5	5	4	3	3	5	3	5
78	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
79	6.3	5	5	4	3	4	4	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
80	6.3	4	3	4	3	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5	4	4
81	6.3	0	0	4	2	5	2	5	5	5	5	3	2	2	3	2	3
82	6.3	2	2	4	2	5	5	5	5	5	5	5	3	4	5	4	5
83	6.3	5	3	4	2	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
84	6.3	3	4	4	2	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	3	5
85	6.3	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
86	6.3	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5
87	6.3	3	4	5	3	5	0	5	5	5	5	4	4	2	4	4	5
88	6.3	4	5	5	3	5	0	5	5	4	5	4	2	4	5	4	5
89	6.3	3	5	5	4	5	0	5	4	5	5	4	3	3	4	3	5
90	6.3	4	5	5	4	3	0	5	5	5	5	4	4	3	4	3	5
91	6.3	5	4	5	3	5	4	5	5	5	5	4	2	4	5	4	5
92	6.3	5	5	5	4	5	3	5	5	5	5	5	4	3	5	5	5
93	6.3	5	4	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
94	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
95	6.3	5	4	5	3	5	5	5	5	5	5	4	3	3	5	4	5
96	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5
97	6.3	5	5	5	3	5	4	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5
98	6.3	5	5	5	3	5	4	5	5	5	5	4	3	4	5	4	5
99	6.3	5	5	5	3	5	5	5	4	5	5	5	4	4	5	5	5

100	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
101	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5
102	1.6	5	4	4	4	5	4	5	5	5	5	5	5	3	5	3	5
103	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
104	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
105	6.3	5	4	5	4	5	4	5	5	5	5	5	4	3	5	4	5
106	6.3	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
107	6.3	0	4	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
108	6.3	2	4	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5
109	6.3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	2	5	3
110	6.3	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5
111	6.3	0	3	4	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	5	4	5
112	6.3	1	4	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
113	6.3	4	3	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5
114	6.3	5	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
115	6.3	3	3	4	3	5	3	5	5	5	5	4	2	3	5	4	5
116	6.3	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
117	6.3	0	3	5	3	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5	4	5
118	6.3	4	3	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
119	6.3	2	4	4	4	5	4	5	4	4	5	4	2	3	4	4	5
120	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
121	6.3	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	4	4	5	5	5
122	6.3	5	4	5	5	5	3	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5
123	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
124	6.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
125	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	4	5
126	1.6	0	0	0	2	4	2	5	3	4	3	1	2	2	2	1	4
127	1.6	3	3	3	3	5	4	5	5	5	5	4	4	4	3	3	5
128	1.6	5	5	3	3	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	4

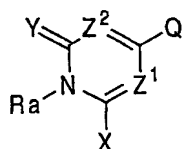
129	1.6	4	0	2	2	5	5	5	5	4	5	4	4	4	5	2	5
130	1.6	2	3	4	2	3	5	5	5	4	5	5	4	4	5	4	5
131	1.6	4	3	2	2	5	3	5	5	4	5	4	2	4	4	3	5
132	1.6	3	2	3	2	4	5	5	5	5	5	4	4	4	5	3	5
133	1.6	4	5	3	3	5	3	5	5	5	5	4	3	3	5	3	5
134	1.6	4	3	2	2	5	5	5	5	4	5	3	5	3	5	2	5
135	1.6	5	5	3	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
136	1.6	5	4	3	3	5	4	5	5	4	5	4	4	3	5	2	5
137	1.6	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	5
138	1.6	5	3	2	3	5	0	5	5	5	5	3	3	2	4	3	5
139	1.6	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5
140	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
141	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	4	4	3	5	3	5
142	1.6	4	3	2	2	5	4	5	5	4	5	4	5	4	4	3	5
143	1.6	4	4	2	4	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	2	5
144	1.6	0	2	2	2	5	2	5	5	4	5	4	2	2	2	2	4
145	1.6	3	3	3	2	5	5	5	5	4	5	4	4	3	5	2	5
146	1.6	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5
147	1.6	3	4	3	2	5	0	5	4	4	4	3	2	2	2	3	5
148	1.6	2	3	2	3	5	0	5	4	5	4	2	2	2	3	3	4
149	1.6	5	5	3	2	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5
150	1.6	5	5	3	2	5	4	5	5	5	5	4	4	3	5	3	5
151	1.6	4	4	3	2	5	4	5	5	5	5	5	4	4	5	3	5
152	1.6	3	2	3	2	5	4	5	5	5	5	4	4	3	4	3	4
153	1.6	4	3	2	2	5	4	5	5	5	5	4	4	4	4	2	5
154	1.6	4	5	3	3	5	5	5	5	5	5	4	3	2	3	4	5
155	1.6	2	0	2	2	5	5	5	5	4	5	2	5	2	4	2	5
156	1.6	4	5	3	3	5	5	5	5	5	5	5	3	3	5	3	5
157	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	5

158	1.6	0	0	0	1	3	1	4	3	2	4	1	2	2	2	2	5
159	1.6	3	2	3	3	5	5	5	5	4	5	4	5	4	5	4	5
160	1.6	5	3	3	3	5	5	5	5	4	5	5	5	4	5	4	5
161	1.6	2	2	3	2	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	3	5
162	1.6	2	0	2	2	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	3	5
163	1.6	0	0	1	2	5	5	5	5	5	5	2	2	3	3	2	5
164	1.6	0	0	3	3	5	5	5	5	4	5	4	2	2	5	2	5
165	1.6	0	0	3	3	5	5	5	5	4	5	4	3	2	5	3	5
166	1.6	3	1	2	2	5	3	5	5	4	5	4	2	2	4	2	5
167	1.6	3	2	4	3	5	5	5	5	5	5	4	3	2	5	3	5
168	1.6	3	2	3	3	5	1	5	5	4	5	4	2	2	4	2	5
169	1.6	0	4	4	3	5	3	5	5	5	5	5	4	2	5	4	5
170	1.6	3	4	4	3	5	3	5	5	5	5	5	2	2	4	4	5
171	1.6	0	0	4	3	5	4	5	5	5	5	4	2	1	4	3	5
172	1.6	4	2	4	3	5	3	5	5	4	5	4	3	1	5	3	5
173	1.6	3	3	4	3	5	3	5	5	5	5	4	2	2	4	4	5
174	1.6	3	0	3	3	5	4	5	5	4	5	4	2	1	5	3	5
175	1.6	3	0	4	3	5	4	5	5	5	5	3	2	-	5	3	5
176	1.6	3	0	3	3	5	4	5	5	4	5	3	2	2	5	3	5
177	1.6	3	0	3	3	5	3	5	5	4	5	3	3	2	4	4	5
178	1.6	0	0	3	2	5	5	5	5	3	5	3	3	1	5	2	5
179	1.6	0	2	3	3	5	4	5	5	4	5	3	2	2	4	2	5
180	1.6	0	0	3	3	5	4	5	5	5	5	3	2	2	4	2	5
181	1.6	0	0	2	3	5	4	5	5	4	5	4	3	2	4	3	5
182	1.6	0	0	3	3	5	4	5	5	4	5	3	3	1	4	3	5
183	1.6	3	3	4	4	5	4	5	5	5	5	4	3	2	5	4	5
184	1.6	5	3	4	4	5	5	5	5	4	5	5	2	3	5	5	5
185	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	3	5	4	5	1	5	4	5
186	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	4	5	5	5	2	5	3	5

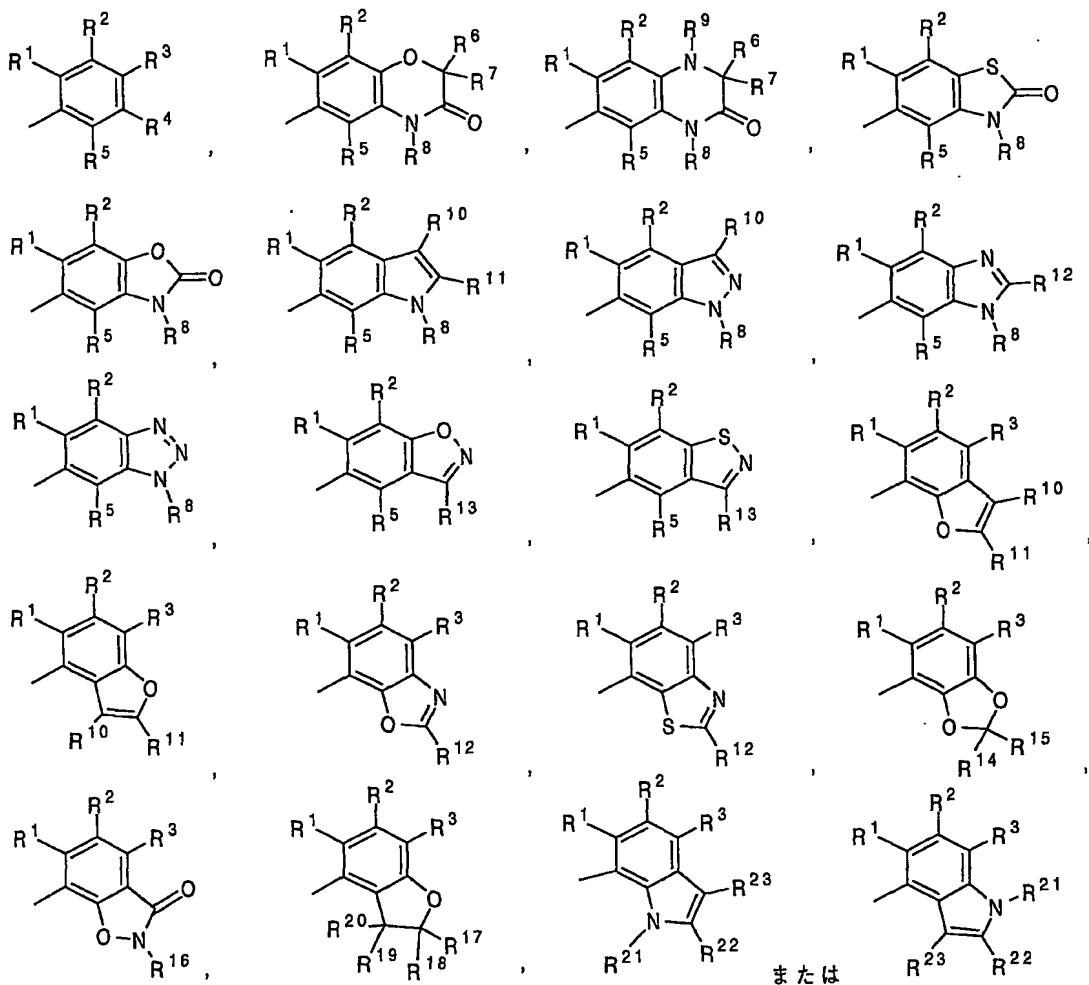
187	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	4	5	5	5	2	5	4	5
188	1.6	0	0	4	4	5	5	5	5	5	5	4	4	3	5	3	5
189	1.6	0	0	5	3	5	5	5	5	4	5	5	2	3	5	4	5
190	1.6	0	0	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	2	5	4	5
191	1.6	0	0	3	3	5	5	5	5	4	5	4	4	2	5	3	5
192	1.6	0	0	3	3	5	4	5	5	4	5	4	4	2	5	3	5
193	1.6	0	0	4	3	5	5	5	5	4	5	4	4	3	5	3	5
194	1.6	2	4	3	3	2	1	5	4	5	5	3	2	2	4	3	5
195	1.6	0	3	3	3	5	2	5	5	5	5	3	2	2	4	4	5
196	1.6	5	3	4	5	5	4	5	5	5	5	4	4	2	5	4	5
197	1.6	5	3	4	4	5	4	5	5	5	5	5	2	3	5	4	5
198	1.6	5	3	4	4	5	4	5	5	5	5	5	2	2	5	3	5
199	1.6	4	3	5	4	5	4	5	5	5	5	5	3	3	5	5	5
200	1.6	5	3	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5
201	1.6	0	0	1	2	3	2	4	2	2	5	2	1	1	2	1	5
230	1.6	0	0	1	2	3	0	5	4	3	4	2	1	3	2	2	4
202	1.6	1	5	3	3	5	5	5	5	4	5	4	2	2	5	2	5
203	1.6	1	5	4	4	5	5	5	5	5	5	4	3	4	5	4	5
204	1.6	3	5	4	4	5	3	5	5	5	5	4	3	3	4	4	5
205	1.6	3	5	3	2	4	0	5	4	4	5	1	4	2	3	3	2
206	1.6	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	4	5

請求の範囲

1. 式(1) :



〔式中、Q-は式(2) :



を表し、

R_a は水素原子、シアノ基、 C_1-C_4 アルキル基、シアノ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルチオ C_1-C_4 アル

キル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、 $(C_1-C_4$ アルキル)カルボニル基または $(C_1-C_4$ アルコキシ)カルボニル基を表し、

Xは水素原子、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、アミノ基、 C_1-C_4 アルキルアミノ基、または $(C_1-C_4$ アルキル)₂アミノ基を表し、

Yは酸素原子または硫黄原子を表し、

Z^1 および Z^2 はそれぞれ独立して窒素原子またはCRbを表し、但し、 Z^1 が窒素原子を表すときは Z^2 はCRbを表し、 Z^1 がCRbを表すときは Z^2 は窒素原子を表し、

Rbは水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基またはシアノ基を表し、

R^1 および R^2 はそれぞれ独立しては水素原子またはハロゲン原子を表し、

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、メルカプト基、アミノ基、ホルミル基、カルボキシル基、シアノメチル基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、スルファモイル基、チオカルバモイル基、カルバモイル基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、トリメチルシリルエチニル基、 C_1-C_4 アルキルアミノ基、 $(C_1-C_4$ アルキル)₂アミノ基、置換フェニル基、置換フェニルカルボニル基、置換フェニルカルボニルオキシ基、置換フェニルメチル基、置換フェニルスルホニル基、置換フェニル-L-O、置換フェニル-L-NH、置換フェニル-L-Sまたは C_1-C_4 アルキルOC(O)-L-Oを表し、

R^4 は水素原子、ハロゲン原子、ホルミルアミノ基、シアノ基、クロロスルホニル基、ニトロ基、ヒドラジノ基、置換フェニル基、1,3-ジオキソラン-2-イル基、1,3-ジオキサソ-2-イル基、 C_1-C_8 アルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_1-C_8 ハロ

アルキル基、 C_3-C_8 ハロゲンシクロアルキル基、 C_2-C_8 ハロアルケニル基、 C_2-C_8 ハロアルキニル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル基、 $R^{30}O$ 、 $R^{30}-L-O$ 、 $R^{30}C(O)-L-O$ 、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジルオキシ基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、2-ピリミジニルオキシ基、2-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基、5-クロロ-2-ピリジルオキシ基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジルオキシ基、 $R^{30}S$ 、 $R^{30}NH$ 、 $R^{31}OC(O)$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)$ 、 $R^{33}SO_2NHC(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L$ 、 $R^{30}C(O)-R^{30}-L$ 、 $R^{31}OC(O)-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)-L-NH$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-NH$ 、 $R^{30}C(O)-L-NH$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S$ 、 $R^{31}OC(O)-L-S(O)$ 、 $R^{31}OC(O)-L-SO_2$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-S$ 、 $R^{30}C(O)-L-S$ 、 $R^{34}SO_2NH$ 、 $(R^{34}SO_2)_2N$ 、 $R^{34}SO_2(R^{35})N$ 、 $R^{36}OC(O)NH$ 、 $R^{36}OC(O)(R^{35})N$ 、 $R^{31}OC(O)-L-(R^{35})N$ 、 $R^{31}R^{32}NC(O)-L-(R^{35})N$ 、置換フェニル $(R^{35})N$ 、 $R^{30}R^{35}N$ 、 $R^{36}CONH$ 、 $R^{36}C(O)(R^{35})N$ 、 $R^{37}ON=CH$ 、 (C_1-C_4) アルコキシ $_2P(O)-L$ 、 $R^{30}O-L$ 、 $R^{30}S-L$ 、 $R^{30}NH-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L$ 、 $R^{30}S(O)-L$ 、 $R^{30}SO_2-L$ 、 $NC-L$ 、 $R^{30}CO_2-L$ 、 $R^{30}C(O)-L$ 、 $R^{31}R^{32}N-L-O$ 、 $R^{31}R^{32}NCO_2$ 、 $(R^{38}O)R^{31}NC(O)-L$ 、(2-クロロ-4-ブタノリド-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、 $R^{38}-O-N=C(R^{37})-L-O$ 、 $R^{31}OC(O)C_1-C_4$ アルキレン $-O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{30}C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{30}-O-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-O$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})-L-S$ 、 $R^{39}O-C(=NOR^{38})$ 、 $R^{31}R^{32}NC(=NOR^{38})-L$ 、 $R^{39}O-C(=NNR^{31}R^{32})-L$ 、 (C_1-C_4) アルキル $_3Si-L-O$ 、 (C_1-C_4) アルキル $_3Si-L-O-CH_2-O$ または置換されていてもよい5~6員のヘテロ環を表し、

R^5 は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシ基、メルカプト基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-

C₈アルキニル基、C₁–C₄アルコキシ基、C₁–C₄ハロアルキル基、C₂–C₈アルケニルオキシ基、C₂–C₈アルキニルオキシ基、2, 3-エポキシ-2-メチルプロピル基または2-メチル-2-プロペニル基を表し、

R⁶およびR⁷はそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁–C₆アルキル基、シアノ基またはC₁–C₆ハロアルキル基を表し、

R⁸およびR⁹はそれぞれ独立して水素原子、C₁–C₈アルキル基、C₂–C₈アルケニル基、C₂–C₈アルキニル基、C₁–C₈ハロアルキル基、C₂–C₈ハロアルケニル基、C₂–C₈ハロアルキニル基、(C₁–C₆アルキル)カルボニル基、(C₁–C₆ハロアルキル)カルボニル基、ホルミル基、ベンゾイル基、フェナシル基、C₃–C₈シクロアルキルC₁–C₄アルキル基、C₁–C₄アルコキシC₁–C₄アルキル基、C₁–C₄アルコキシ基、(C₁–C₆アルコキシ)カルボニル基、C₁–C₆アルキルスルホニル基、NC–L、R³¹OC(O)–L、R³¹R³²NC(O)–L、R³⁹OC(=NOR³⁸)–L、R³¹R³²NC(=OR³⁸)–L、R³¹OC(O)–L–O、R³¹R³²NC(O)–L–O、R³⁹OC(=NOR³⁸)–L–O、R³¹R³²NC(=OR³⁸)–L–Oまたは置換フェニル–Lを表し、

R¹⁰は水素原子、ハロゲン原子、C₁–C₆アルキル基、(C₁–C₄アルコキシ)カルボニル基または(C₁–C₄アルキル)カルボニル基を表し、

R¹¹は水素原子、ホルミル基、カルボキシル基、ヒドロキシメチル基、C₁–C₆アルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、(C₁–C₆アルキル)カルボニル基、C₁–C₄アルコキシC₁–C₄アルキル基、C₁–C₄アルキルチオC₁–C₄アルキル基、C₁–C₄アルキルスルホニルC₁–C₄アルキル基、(C₁–C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₁–C₄アルキル)アミノカルボニル基、C₁–C₄アルキル–CH(OH)、C₂–C₄アルケニル–CH(OH)、C₃–C₈シクロアルキル–CH(OH)または(C₃–C₈シクロアルキル)カルボニル基を表し、

R¹²は水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、C₁–C₆アルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、C₁–C₆アルコキシ基、C₁–C₆アルキルチオ基またはC₁–C₄アルコキシ(C₁–C₄)アルキル基を表し、

R¹³は水素原子、C₁–C₆アルキル基または置換フェニル基を表し、

R^{14} および R^{15} はそれぞれ独立して水素原子または C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{16} は水素原子または C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} および R^{20} はそれぞれ独立して水素原子または C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{21} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_6 ハロアルキル)カルボニル基、(C_1-C_6 アルコキシ)カルボニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 ハロアルキルスルホニル基または C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基を表し、

R^{22} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、ヒドロキシ C_1-C_4 アルキル基または C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基を表し、

R^{23} は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ニトロ基、アミノ基、シアノ基、ホルミル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_4 ハロアルキル)カルボニル基、カルボキシ基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、ヒドロキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、 $R^{38}ON=CH$ または $R^{38}ON=C(C_1-C_4アルキル)$ を表し、

R^{30} は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_8 ハロアルキル基、 C_2-C_8 ハロアルケニル基、 C_2-C_8 ハロアルキニル基、4-ブタノリド-2-イル基、5-ペンタノリド-2-イル基、6-ヘキサノリド-2-イル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、(C_1-C_4 アルキル)₂アミノカルボニル基、 C_3-C_8 シクロアルケニル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロフラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)メチル基、(C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル)₂ C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロピラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、(フラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_2-C_8 アルキニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ C_1-C_4 ア

ルキル基、置換フェニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、置換フェニル C_2-C_8 アルキニル基、置換フェニル C_2-C_8 アルケニル基、シアノ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルキルチオ C_1-C_4 アルキル基、ベンジルオキシメチル基、テトラヒドロピラン-2-イル基、オキシラニル基、オキシラニルメチル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、(C_1-C_8 アルキル)カルボニル基、シアノ C_2-C_8 アルケニル基、(C_1-C_4 ハロアルキル)カルボニル基、置換フェニル基、(テトラヒドロフラン-3-イル) C_1-C_4 アルキル基、(3-メチルオキセタン-3-イル) C_1-C_4 アルキル基、(2-ピロリドン-1-イル) C_1-C_4 アルキル基、(C_2-C_8 アルケニル)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル)カルボニル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、 C_1-C_8 アルキルスルホニル基、 C_1-C_8 ハロアルキルスルホニル基、(C_1-C_4 アルキル)カルボニルオキシ C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 ハロアルコキシ)カルボニル基、(置換されていてもよい5から6員ヘテロ環) C_1-C_4 アルキル基、テトラヒドロピラン-3-イル基、テトラヒドロピラン-4-イル基、(テトラヒドロピラン-3-イル) C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロピラン-4-イル) C_1-C_4 アルキル基または1-メチルピロリジン-3-イル基を表し、

R^{31} は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、オキセタン-3-イル基、 C_1-C_4 アルキルアミノ基、(C_1-C_4 アルキル) $_2$ アミノ基、 C_1-C_4 アルキリデンイミノ基、置換されていてもよいフェニル基、ベンジル基、(C_2-C_8 アルケニル)オキシカルボニル C_1-C_4 アルキル基、(C_2-C_8 アルキニル)オキシカルボニル C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキル基、(テトラヒドロフラン-2-イル) C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 アルキル) $_2$ アミノ C_1-C_4 アルキル基、置換されていてもよい5から6員ヘテロ環、 C_2-C_6 ハロアルケニル基または C_1-C_4 アルキルチオ C_1-C_4 アルキル基を表し、

R^{32} は水素原子、 C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基または C_1-C_6 ハロアルキル基を表し、但し、 R^{31} と R^{32} は結合している窒素原子とともに C_1-C_4 アルキル基で置換されていても良い3から8員のヘテロ環を表していてもよく、そのときのヘテロ環の構成要素は炭素、酸素、硫黄および窒素原子から任意に選択され、

R^{33} は C_1-C_4 アルキル基または C_1-C_4 ハロアルキル基を表し、

R^{34} は C_1-C_8 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ベンジル基またはフェニル基を表し、

R^{35} は C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_2-C_8 ハロアルケニル基、 C_2-C_8 ハロアルキニル基、シアノ C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルキル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキル基、ホルミル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_6 ハロアルキル)カルボニル基または置換フェニルカルボニル基を表し、

R^{36} は C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、置換フェニル基または置換フェニル C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{37} は C_1-C_6 アルキル基または(C_1-C_3 アルコキシ)カルボニル C_1-C_6 アルキル基を表し、

R^{38} は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_8 シクロアルキル基またはベンジル基を表し、

R^{39} は C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、(C_1-C_6 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_6 アルコキシ)カルボニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基または(C_1-C_4 アルコキシ) $_2P(O)$ を表し、

Lは飽和あるいは不飽和の分岐していてもよく、ハロゲン原子、シアノ基または(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基によって置換されていてもよい C_1-C_6 のアルキレン鎖を表し、

置換フェニルはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシル

基、ヒドロキシ基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、(C_1-C_4 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキルオキシ基、 $OCH(CH_3)CO_2H$ 、 OCH_2CO_2H 、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、 C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ基、(C_1-C_4 アルコキシ C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルコキシ基、(C_1-C_4 アルケニルオキシ C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルコキシ基、(C_1-C_4 アルキニルオキシ C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルコキシ基または(C_1-C_4 ハロアルコキシ C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルコキシ基によって任意に置換されていてもよいフェニル基を表し、

置換されていてもよい5から6員ヘテロ環はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、(C_1-C_4 アルキル)カルボニル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル C_1-C_4 アルキルオキシ基、 $OCH(CH_3)CO_2H$ 、 OCH_2CO_2H または(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基によって任意に置換されていてもよい5から6員ヘテロ環を表し、

但し、これらの化合物に光学活性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの混合物および単離された異性体の双方を包含する。)で示されるピリミジノン誘導体およびその塩。

2. R_a が C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基または C_1-C_4 アルキルスルホニル基を表し、

X が水素原子、 C_1-C_4 アルキル基またはアミノ基を表し、

Y が酸素原子を表し、

Z^1 が窒素原子を表し、

Z^2 が CR_b を表し、

R_b がハロゲン原子を表し、

R^1 が水素原子またはフッ素原子を表し、

R^2 が水素原子を表す請求項1記載のピリミジノン誘導体およびその塩。

3. Xがメチル基を表す請求項2記載のピリミジノン誘導体およびその塩。
4. R_aがCHF₂またはCF₃を表す請求項2記載のピリミジノン誘導体およびその塩。
5. 請求項1記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する農薬。
6. 請求項1記載のピリミジノン誘導体およびその塩を有効成分として含有する除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Beck, James R.; Babbitt, George E.; Lynch, Michael P. Synthesis of ethyl 2-[(1-aryl-1H-1,2,4-triazol-3-yl)oxy]propionates and related derivatives, J. Heterocycl. Chem. (1988), 25(5), 1467-70, compound [9]	1
X	Breuker, Koos; Van der Plas, Henk C., Occurrence of an SN(ANRORC) mechanism in the Chichibabin amination of 4-phenylpyrimidine, J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80, compound 3	1
X	JP, 05-124924, A (Sansho Seiyaku Co., Ltd.), 21 May, 1993 (21.05.93), compounds 1-10 (Family: none)	1
P, X	WO, 01/10843, A (Mitsubishi Chemical Corporation), 15 February, 2001 (15.02.01) (Family: none)	1
P, X	JP, 2000-264888, A (Zaidan Hojin Sagami Chuo Kagaku Kenkyusho), 26 September, 2000 (26.09.00), working example (Family: none)	1

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
16 April, 2001 (16.04.01)Date of mailing of the international search report
24 April, 2001 (24.04.01)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Vroegop, S. M.; Chapman, D. L.; Decker, D. E.; Galinet, L. A.; Brideau, R. J.; Ready, K. A.; Dunn, C. J.; Buxser, S. E. Pharmacokinetic properties, induction of interferon, and efficacy if selected 5-halo-6-phenyl pyrimidinones, broprimine analogues, in a model of severe experimental autoimmune encephalomyelitis, Int. J. Immunopharmacol. (1999), 21(10), 647-662; page 650, table	1
X	Abdel-Megid, Mohamed Synthesis of pyrimido[4,5-d]pyrimidinethione derivatives as biocidal agents, Heterocycl. Commun. (1998), 4(3), 235-243	1
X	WO, 98/25596, A (Pharmacia & Upjohn Co.), 18 June 1998 (18.06.98) & EP, 948331, A	1
X	Attaby, Fawzy A.; Eldin, Sanaa M.; Hanafi, Eman A. Z. Reactions of pyrimidinonethione derivatives: synthesis of 2-hydrazinopyrimidin-4-one, pyrimido[1,2-a]-1,2,4-triazine, triazolo-[1,2-a] pyrimidine, 2-(1-pyrazolo)pyrimidine and 2-arylhydrazonopyrimidine derivatives, Arch. Pharmacol. Res. (1997), 20(06), 620-628	1
X	JP, 09-241161, A (Nippon Shinyaku Co., Ltd.), 16 September, 1997 (16.09.97), reference examples 1, 4 (Family: none)	1
X	Naghipur, G. A.; Saharia, G. S.; Sharma, D. P.; Sharma, H. R. Studies in heterocyclic compounds. Part XLV. 4-Methyl-6-aryl-5-(aryloxy/N-substituted p-sulfamoylbenzenazo)pyrimidin-2-ols, J. Inst. Chem. (India) (1996), 68(2), 37-40	1
X	Krylova, L. F.; Shamovskaya, G. I.; Golovin, A. V.; Nogina, N. I., ortho-Palladated complexes containing isomeric 2- and 6-phenyl-4-pyrimidinones, Zh. Neorg. Khim. (1996), 41(3), 402-410; page 410, left column	1
X	WO, 94/06777, A (Zeneca Ltd.), 31 March, 1994 (31.03.94), working example IA & EP, 660827, A	1
X	Ram, Vishnu J., Chemotherapeutic agents: XVIII. Synthesis of .pi.-deficient pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicidal agents, Arch. Pharm. (Weinheim, Ger.) (1990), 323(11), 895-9, compounds 2, 3	1,2
X	Ram, Vishnu Ji, Chemotherapeutic agents. XII. Synthesis of pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicides and herbicides, J. Prakt. Chem. (1989), 331(6), 893-905	1-6
X	El-Sharabsy, Salwa A.; Abdel Gawad, Soad M.; Hussain, Sohair M., Reactions with substituted acrylonitriles: a novel synthesis of polysubstituted pyrimidines, J. Prakt. Chem. (1989), 331(2), 207-11, compounds 5a-h	1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 63-30473, A (Zeria Shinyaku Kogyo K.K.), 09 February, 1988 (09.02.88), Claims; working example (Family: none)	1
X	Li, L. H.; DeKoning T. F.; Nicholas, J. A.; Kramer, G. D.; Wilson, D.; Wallace, T.L.; Collins, M. J., Jr. Effect of mouse hepatitis virus infection on combination therapy of P388 leukemia with cyclophosphamide and pyrimidinones, Lab. Anim. Sci. (1987), 37(1), 41-4, compounds ABPP, ABMFPP, AIMFPP	1
X	Sidky, Younan A.; Borden, Ernest C.; Wierenga, Wendell; Bryan, George T., Inhibitory effects of interferon-inducing pyrimidinones on the growth of transplantable mouse bladder tumors., Cancer Res. (1986), 46(8), 3798-802, Fig. I	1
X	Skulnick, Harvey I.; Weed, Shaldon D.; Eidson, Emerson E.; Renis, Harold E.; Stringfellow, Dale A.; Wierenga, Wendell Pyrimidinones. 1. 2-Amino-5-halo-6-aryl-4(3H)-pyrimidinones. Interferon-inducing antiviral agents, J. Med. Chem. (1985), 28(12), 1864-9	1
X	JP, 56-154464, A (Efu Bii Shii Ltd.), 30 November, 1981 (30.11.81), example 56 & US, 4414221, A	1
X	JP, 55-127378, A (Upjohn Co.), 02 October, 1980 (02.10.80), Claims; working example & US, 4507302, A	1
X	Mass spectra of 2-thioxopyrimidine derivatives, Kishi, Hiroshi; Kambe, Satoshi, Shitsuryo Bunseki (1979), 27(2), 83-95; page 84, lower left side	1
X	Wynalda, M. A.; Fitzpatrick, F. A. High-performance liquid chromatographic determination of 5-halopyrimidinone interferon inducers, Anal. Chem. (1980), 52(12), 1931-4	1
X	US, 3829422, A (SANDOZ), 13 August, 1974 (13.08.74), examples 1, 4, 9 & US, 3663698, A	1,2
X	JP, 04-49279, A (Nihon Bayer Agrochem. K.K.), 18 February, 1992 (18.02.92), Claims; working example 18 (Family: none)	1-6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☒ Claims Nos.: 1-6
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

See extra sheet.
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

The compounds of the invention do not have any novel common basic skeleton in their chemical structures.

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP01/02158

Continuation of Box No.I-2 of continuation of first sheet(1)

A group of inventions of claims 1-4 and the inventions of claims 5 and 6 relate to compounds of the general formula (I), pesticides containing the same as the active ingredient, or the like. However, the smallest compounds represented by the general formula (I), which correspond to the case wherein $R_a=R_b=X=H$ and $Q=Ph$ ($R^1=R^2=R^3=R^4=R^5=H$), are publicly known, because they are disclosed in

J. Heterocycl. Chem. (1988), 25(5), 1467-70;

J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80; and

JP, 05-124924, A.

Accordingly, the compounds of the general formula (I) do not have any novel common basic skeleton in their structures, so that one invention cannot be grasped from each of the above claims carrying the compounds.

On the other hand, many specific examples of the above compounds are disclosed in the description; still, these examples correspond to only a small part of an extremely wide range of compounds included among those described above.

Therefore, the above claims and the description fail to comply with the prescribed requirements to such an extent that a meaningful search could not be carried out.

In this international search report, search was made in the sight of the disclosure of the description, with the non-fused phenyl groups defined as to Q being limited to those having ring-substituent halogen atoms.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int cl⁷ C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int cl⁷ C07D239/36, C07D239/47, C07D403/04, C07D405/04, C07D413/04, A01N43/54

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Beck, James R.; Babbitt, George E.; Lynch, Michael P. Synthesis of ethyl 2-[(1-aryl-1H-1,2,4-triazol-3-yl)oxy]propionates and related derivatives, J. Heterocycl. Chem. (1988), 25 (5), 1467-70, 化合物 [9]	1
X	Breuker, Koos; Van der Plas, Henk C., Occurrence of an SN(A NRORC) mechanism in the Chichibabin amination of 4-phenylpyr imidine, J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80, 化合物 3	1

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

16.04.01

国際調査報告の発送日

24.04.01

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一

4C

8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き). 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	J P, 05-124924, A (三省製薬株式会社) 21. 5月. 1993 (21. 05. 93), 化合物1-10 (ファミリーなし)	1
P、X	WO, 01/10843, A (三菱化学株式会社) 15. 2月. 2 001 (15. 02. 01) (ファミリーなし)	1
P、X	J P, 2000-264888, A (財団法人相模中央化学研究 所) 26. 9月. 2000 (26. 09. 00), 実施例、(ファ ミリーなし)	
X	Vroegop, S. M.; Chapman, D. L.; Decker, D. E.; Galinet, L. A.; Brideau, R. J.; Ready, K. A.; Dunn, C. J.; Buxser, S. E. Pharmacokinetic properties, induction of interferon, and eff icacy of selected 5-halo-6-phenyl pyrimidinones, broprimine analogues, in a model of severe experimental autoimmune enc ephalomyelitis, Int. J. Immunopharmacol. (1999), 21(10), 647 -662, p650の表	1
X	Abdel-Megid, Mohamed Synthesis of pyrimido[4,5-d]pyrimidineth ione derivatives as biocidal agents, Heterocycl. Commun. (1 998), 4(3), 235-243	1
X	WO, 98/25596, A (Pharmacia & Upjohn Co.) 18. 6 月. 1998 (18. 06. 98) & EP, 948331, A	1
X	Attaby, Fawzy A.; Eldin, Sanaa M.; Hanafi, Eman A. Z. Reactions of pyrimidinonethione derivatives: synthesis of 2 -hydrazinopyrimidin-4-one, pyrimido[1,2-a]-1,2,4-triazine, tr iazolo-[1,2-a]pyrimidine, 2-(1-pyrazolo)pyrimidine and 2-ary lhydrazonopyrimidine derivatives, Arch. Pharmacol Res. (199 7), 20(6), 620-628	1
X	J P, 09-241161, A (日本新薬株式会社) 16. 9月. 1997 (16. 09. 97), 参考例1, 4 (ファミリーなし)	1
X	Naghipur, G. A.; Saharia, G. S.; Sharma, D. P.; Sharma, H. R. Studies in heterocyclic compounds. Part XLV. 4-Methyl-6-a ryl-5-(arylozo/N-substituted p-sulfamoylbenzenazo)pyrimidin- 2-ols, J. Inst. Chem. (India) (1996), 68(2), 37-40	1
X	Krylova, L. F.; Shamovskaya, G. I.; Golovin, A. V.; Nogina, N. I., ortho-Palladated complexes containing isomeric 2- an d 6-phenyl-4-pyrimidinones, Zh. Neorg. Khim. (1996), 41(3), 402-410, p410左欄	1

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO, 94/06777, A (ZENECA Ltd.) 31. 3月. 1994 (31. 03. 94) 実施例 I A & EP, 660827, A	1.
X	Ram, Vishnu J., Chemotherapeutic agents. XVIII. Synthesis of .pi.-deficient pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicidal agents, Arch. Pharm. (Weinheim, Ger.) (1990), 323 (11), 895-9, 化合物 2, 3	1、2
X	Ram, Vishnu Ji, Chemotherapeutic agents. XII. Synthesis of pyrimidines and fused pyrimidines as leishmanicides and herbicides, J. Prakt. Chem. (1989), 331(6), 893-905	1-6
X	El-Sharabsy, Salwa A.; Abdel Gawad, Soad M.; Hussain, Sohair M., Reactions with substituted acrylonitriles: a novel synthesis of polysubstituted pyrimidines, J. Prakt. Chem. (1989), 331(2), 207-11, 化合物 5 a - h	1
X	JP, 63-30473, A (ゼリア新薬工業株式会社) 9. 2月. 1988 (09. 02. 88) 特許請求の範囲、実施例 (ファミリーなし)	1
X	Li, L. H.; DeKoning, T. F.; Nicholas, J. A.; Kramer, G. D.; Wilson, D.; Wallace, T. L.; Collins, M. J., Jr. Effect of mouse hepatitis virus infection on combination therapy of P388 leukemia with cyclophosphamide and pyrimidinones, Lab. Anim. Sci. (1987), 37(1), 41-4, 化合物 A B P P, A B M F P P, A I M F P P	1
X	Sidky, Younan A.; Borden, Ernest C.; Wierenga, Wendell; Bryan, George T., Inhibitory effects of interferon-inducing pyrimidinones on the growth of transplantable mouse bladder tumors, Cancer Res. (1986), 46(8), 3798-802, Fig. I	1
X	Skulnick, Harvey I.; Weed, Sheldon D.; Eidson, Emerson E.; Renis, Harold E.; Stringfellow, Dale A.; Wierenga, Wendell P pyrimidinones. 1. 2-Amino-5-halo-6-aryl-4(3H)-pyrimidinones. Interferon-inducing antiviral agents, J. Med. Chem. (1985), 28(12), 1864-9	1
X	JP, 56-154464, A (エフ・ビーズ) 30. 11月. 1981 (30. 11. 81) 例 56 & US, 4414221, A	1
X	JP, 55-127378, A (アップジョン) 2. 10月. 1980 (02. 10. 80), 特許請求の範囲、実施例 & US, 4507302, A	1

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	Mass spectra of 2-thioxopyrimidine derivatives, Kishi, Hiroshi; Kambe, Satoshi, Shitsuryo Bunseki (1979), 27(2), 83-95, 84頁左下	1
X	Wynalda, M. A.; Fitzpatrick, F. A. High-performance liquid chromatographic determination of 5-halopyrimidinone interferon inducers, Anal. Chem. (1980), 52(12), 1931-4	1
X	US, 3 8 2 9 4 2 2, A (SANDOZ) 1 3. 8月. 1 9 7 4 (1 3. 0 8. 7 4) 実施例 1, 4, 9 & US, 3 6 6 3 6 9 8, A	1, 2
X	JP, 0 4 - 4 9 2 7 9, A (日本バイエルアグロケム株式会社) 1 8. 2月. 1 9 9 2 (1 8. 0 2. 9 2) 特許請求の範囲、実施例 1 8 (ファミリーなし)	1 - 6

第 I 欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第 1 ページの 2 の続き)

法第 8 条第 3 項 (PCT 17 条 (2) (a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求の範囲 _____ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
2. ☒ 請求の範囲 1-6 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

別紙参照
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であって PCT 規則 6.4(a) の第 2 文及び第 3 文の規定に従って記載されていない。

第 II 欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第 1 ページの 3 の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

本願発明化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通しているものとはいえない。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☒ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

第 I 欄の 2. について

請求の範囲 1-4 及び同 5, 6 に係る発明は、一般式 (I) で表される化合物又はそれを有効成分とする農薬等の発明であるが、同化合物における最小の化合物である、 $R_a = R_b = X = H$ かつ $Q = Ph$ ($R_1 = R_2 = R_3 = R_4 = R_5 = H$) である化合物が、

J. Heterocycl. Chem. (1988), 25(5), 1467-70

J. Org. Chem. (1979), 44(25), 4677-80

J P, 05-124924, A

により公知であるから、同化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通して有しているものではない。してみれば、このような化合物を記載する上記請求の範囲各項からは、一の発明を明確に把握することができない。

一方、明細書には、上記化合物の具体例が多数開示されているが、それでも、上記化合物に包含される著しく広範な化合物のごく一部のものであるといわざるを得ない。

したがって、上記請求の範囲及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

なお、この国際調査報告では、明細書の記載内容に照らし、一般式 (I) で表される化合物において、Q が、他の環と縮合していないフェニル環であるときは、該フェニル環上にハロゲンが置換している場合のものについて、調査を行った。